

Document made available under the Patent Cooperation Treaty (PCT)

International application number: PCT/EP05/001965

International filing date: 24 February 2005 (24.02.2005)

Document type: Certified copy of priority document

Document details: Country/Office: DE
Number: 10 2004 009 178.1
Filing date: 25 February 2004 (25.02.2004)

Date of receipt at the International Bureau: 12 April 2005 (12.04.2005)

Remark: Priority document submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b)



World Intellectual Property Organization (WIPO) - Geneva, Switzerland
Organisation Mondiale de la Propriété Intellectuelle (OMPI) - Genève, Suisse

BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND**Prioritätsbescheinigung über die Einreichung
einer Patentanmeldung****Aktenzeichen:**

10 2004 009 178.1

Anmeldetag:

25. Februar 2004

Anmelder/Inhaber:

BASF Aktiengesellschaft, 67063 Ludwigshafen/DE

Bezeichnung:Azolopyrimidin-Verbindungen und ihre Verwendung
zur Bekämpfung von Schadpilzen**IPC:**

C 07 D, A 01 N

**Die angehefteten Stücke sind eine richtige und genaue Wiedergabe der ur-
sprünglichen Unterlagen dieser Patentanmeldung.****München, den 22. Dezember 2004
Deutsches Patent- und Markenamt
Der Präsident
Im Auftrag**

Stremme

Azolopyrimidin-Verbindungen und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen

Beschreibung

5

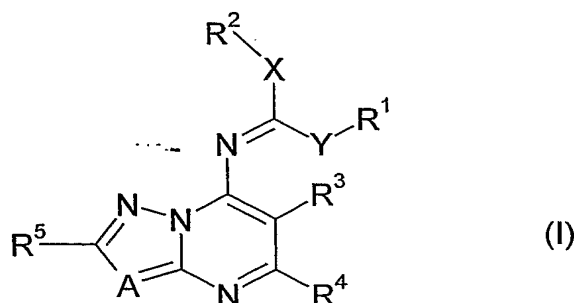
Die vorliegende Erfindung betrifft neue Azolopyrimidin-Verbindungen und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen sowie Pflanzenschutzmittel, die derartige Verbindungen als wirksamen Bestandteil enthalten.

- 10 Die EP-A 71792, US 5,994,360, EP-A 550113, DE-A 10223917, WO 02/48151 und WO 03/080615 beschreiben fungizid wirksame Pyrazolo[1,5-a]pyrimidine und Triazolo[1,5a]pyrimidine, die in der 6-Position des Azolopyrimidinrings eine gegebenenfalls substituierte Phenylgruppe und in der 7-Position NH₂ oder eine primäre oder sekundäre Aminogruppe tragen. Aus der WO 03/009687 sind ähnliche Triazolopyrimidine bekannt, die anstelle des ggf. substituierten Phenylrings in der 6-Position einen gegebenenfalls substituierten und/oder ungesättigten aliphatischen oder cycloaliphatischen Rest aufweisen und in der 7-Position NH₂ oder eine primäre oder sekundäre Aminogruppe tragen.

- 20 Die aus dem Stand der Technik bekannten Azolopyrimidine sind hinsichtlich ihrer fungiziden Wirkung teilweise nicht zufriedenstellend oder besitzen unerwünschte Eigenschaften, wie eine geringe Nutzpflanzenverträglichkeit.

- 25 Der vorliegenden Erfindung liegt daher die Aufgabe zugrunde, neue Verbindungen mit besserer fungizider Wirksamkeit und/oder einer besseren Nutzpflanzenverträglichkeit bereitzustellen.

- 30 Diese Aufgabe wird überraschenderweise gelöst durch Azolopyrimidin-Verbindungen der allgemeinen Formel I



gelöst, worin

- A für N oder C-R⁶ steht;
- X, Y unabhängig voneinander für eine chemische Bindung oder für Sauerstoff, Schwefel oder eine Gruppe N-R⁷ stehen;
- 5 R¹, R² unabhängig voneinander für C₁-C₁₀-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₄-C₁₀-Alkadienyl, C₂-C₁₀-Alkynyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₅-C₈-Cycloalkenyl, C₅-C₁₀-Bicycloalkyl, Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl, Naphthyl, Naphthyl-C₁-C₄-alkyl, 5- oder 6-gliedriges gesättigtes, teilweise ungesättigtes oder aromatisches Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl, die jeweils 1, 2 oder 3 Heteroatome, ausgewählt unter N, O und S, als Ringglieder aufweisen können, stehen, wobei die als R¹, R² genannten Reste teilweise oder vollständig halogeniert sein können oder 1, 2, 3 oder 4 Reste R⁸ aufweisen können, wobei
- 10 Y-R¹ mit X-R² auch gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-, 6 oder 7-gliedrigen, gesättigten oder ungesättigten Carbo- oder Heterocyclus bilden können, wobei letzterer 1, 2, 3 oder 4 Heteroatome, ausgewählt unter O, S und N als Ringglied aufweisen kann, wobei der Carbo- und der Heterocyclus teilweise oder vollständig halogeniert sein können oder 1, 2, 3 oder 4 der Reste R⁷ und/oder R⁸ aufweisen können; wobei
- 15 Y-R¹ und Y-R² unabhängig voneinander auch für Wasserstoff, CN, NO₂ oder Halogen stehen können und wobei einer der Reste Y-R¹ und Y-R²; auch OH, SH oder NH₂ bedeuten kann;
- 20 R³ für C₁-C₁₀-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₄-C₁₀-Alkadienyl, C₂-C₁₀-Alkynyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₅-C₈-Cycloalkenyl, C₅-C₁₀-Bicycloalkyl, Phenyl, Naphthyl, einen 5- oder 6-gliedrigen, gesättigten, teilweise ungesättigten oder aromatischen Heterocyclus, der 1, 2 oder 3 Heteroatome, ausgewählt unter N, O und S, als Ringglieder aufweisen kann, steht, wobei die als R³ genannten Reste teilweise oder vollständig halogeniert sein können oder 1, 2, 3 oder 4 Reste R⁹ aufweisen können;
- 25 R⁴ Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Haloalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₅-C₈-Cycloalkenyl, OR¹⁰, SR¹⁰, NR¹¹R¹², CH₂NR¹¹R¹² oder C(W)R¹³ bedeutet;
- 30 R⁵, R⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff, CN, NO₂, NH₂, CH₂NH₂, Halogen, C(W)R¹³, C(=N-OR¹⁵)R¹⁴, NHC(W)R¹⁶, C₁-C₆-Haloalkyl, C₁-C₄-Alkyl oder C₂-C₄-Alkenyl stehen;
- 35 R⁷ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Haloalkyl, C₁-C₆-Haloalkoxy, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, CN oder C(W)R¹⁷ steht;
- 40 M/45025
- 45

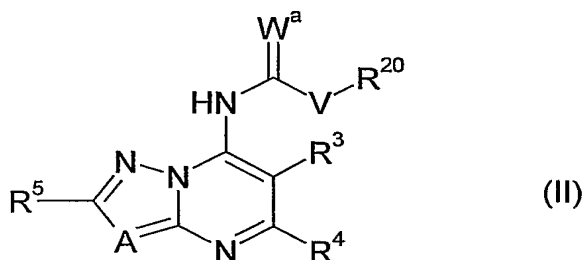
- 5 R^8 ausgewählt ist unter Halogen, Cyano, Nitro, OH, SH, $NR^{18}R^{19}$, C_1 - C_6 -Alkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, Hydroxy- C_1 - C_6 -alkyl, Hydrox- C_1 - C_6 -yalkoxy, C_1 - C_6 -Alkoxy- C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy- C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_1 - C_6 -Haloalkoxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkenyloxy, C_2 - C_6 -Alkinylyl, C_2 - C_6 -Alkinyloxy, C_1 - C_6 -Alkylamino, $C(W)R^{13}$, $C(=N-OR^{15})R^{14}$, $NHC(W)R^{16}$, Tris- C_1 - C_6 -alkylsilyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl und Phenyl, das seinerseits 1, 2 oder 3 Reste aufweisen kann, die ausgewählt sind unter Cyano, Nitro, Halogen, OH, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_1 - C_6 -Haloalkoxy und C_1 - C_6 -Alkylthio;
- 10 R^9 für Halogen, Cyano, NH_2 , NO_2 , C_1 - C_6 -Alkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_1 - C_6 -Haloalkoxy, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkenyloxy, $C(W)R^{13}$, $C(=N-OR^{15})R^{14}$ oder $NHC(W)R^{16}$, steht;
- 15 R^{10} Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl oder $C(W)R^{13}$ bedeutet;
- 20 R^{11} , R^{12} unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_4 - C_6 -Alkadienyl, C_2 - C_6 -Alkinylyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_5 - C_8 -Cycloalkenyl, stehen, wobei die als R^{11} , R^{12} genannten Reste teilweise oder vollständig halogeniert sein können oder 1, 2, 3 oder 4 Reste R^8 aufweisen können, wobei R^{11} auch für eine Gruppe $C(W)R^{13}$ stehen kann und wobei
- 25 R^{11} , R^{12} auch gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-, 6 oder 7-gliedrigen, gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus bilden können, der zusätzlich 1, 2 oder 3 weitere Heteroatome, ausgewählt unter O, S und N, als Ringglied aufweisen kann, wobei der Heterocyclus teilweise oder vollständig halogeniert sein und/oder 1, 2, 3 oder 4 der Reste R^8 aufweisen kann;
- 30 R^{13} für Wasserstoff, OH, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_1 - C_6 -Haloalkoxy, C_2 - C_6 -Alkenyl oder $NR^{18}R^{19}$ steht;
- 35 R^{14} , R^{15} unabhängig voneinander Wasserstoff oder C_1 - C_6 -Alkyl bedeuten;
- R^{16} , R^{17} unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, NH_2 , C_1 - C_6 -Alkylamino oder Di- C_1 - C_6 -alkylamino stehen;
- 40 R^{18} , R^{19} unabhängig voneinander die für R^{11} und R^{12} genannten Bedeutungen aufweisen; und
- W für Sauerstoff oder Schwefel steht;

4

durch die Tautomere der Verbindungen I sowie durch die landwirtschaftlich verträglichen Salze der Verbindungen I und von deren Tautomeren.

5 Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind somit die Azolopyrimidin-Verbindungen der allgemeinen Formel I und deren landwirtschaftlich verträglichen Salze. Gegenstand der Erfindung sind auch deren Tautomere und die landwirtschaftlich verträglichen Salze dieser Tautomere.

10 Tautomere von Azolopyrimidin-Verbindungen der allgemeinen Formel I sind insbesondere die Verbindungen der nachstehend angegebenen Formel II



15 worin A, R³, R⁴ und R⁵ die zuvor für Formel I angegebenen Bedeutungen aufweisen,

V für eine chemische Bindung oder für Sauerstoff, Schwefel oder eine Gruppe N-R⁷ steht;

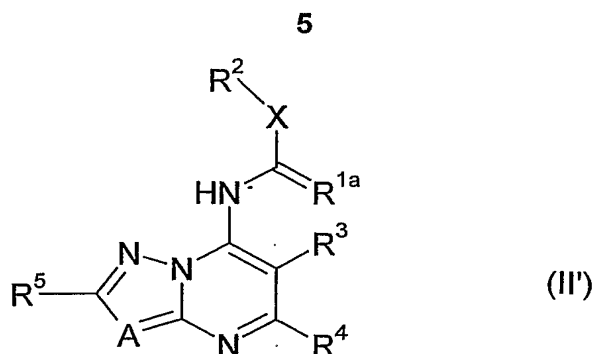
20 W^a für O, S oder eine Gruppe N-R²¹ steht;

R²⁰ eine der in Formel I für R¹ bzw. R² angegebenen Bedeutungen aufweist;

25 R²¹ eine der in Formel I für R¹ bzw. R² angegebenen Bedeutungen aufweist, wobei R²¹ auch für Wasserstoff stehen kann; und

30 wenn W^a für N-R²¹ steht, V-R²⁰ und N-R²¹ gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-, 6 oder 7-gliedrigen ungesättigten Heterocyclen bilden können, wobei letzterer 1, 2, 3 oder 4 Heteroatome, ausgewählt unter O, S und N als Ringglied aufweisen kann, der teilweise oder vollständig halogeniert sein kann oder 1, 2, 3 oder 4 der zuvor genannten Reste R⁸ aufweisen kann. Hierbei handelt es sich um Tautomere von solchen Verbindungen der Formel I, worin einer der Reste Y-R² oder X-R¹ für OH, SH, NH₂ oder NHR¹ bzw. NHR² (d.h. R⁷ steht für Wasserstoff).

35 Zu den Tautomeren von Verbindungen der allgemeinen Formel I zählen weiterhin auch Verbindungen der Formel II'.



worin A, X, R², R³, R⁴ und R⁵ die zuvor angegebenen Bedeutungen aufweisen, und R^{1a} dem Rest R¹, abzüglich eines Wasserstoffatoms an der Bindungsstelle entspricht.

- 5 Hierbei handelt es sich um Tautomere von Verbindungen der Formel I, worin Y eine Einfachbindung bedeutet und R¹ wenigstens ein enolisierbares Wasserstoffatom aufweist. In den Tautomeren der Formel II' kann R^{1a} mit X-R² und dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, auch einen 5-, 6 oder 7-gliedrigen, ungesättigten Carbo- oder Heterocyclus bilden, wobei letzterer 1, 2, 3 oder 4 Heteroatome, ausgewählt unter
- 10 O, S und N als Ringglied aufweisen kann, wobei der Carbo- und der Heterocyclus teilweise oder vollständig halogeniert sein können oder 1, 2, 3 oder 4 der Reste R⁷ und/oder R⁸ als Substituenten aufweisen können.

- Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist weiterhin die Verwendung der Azolopyrimidin-Verbindungen der allgemeinen Formel I, ihrer Tautomere und deren landwirtschaftlich
- 15 verträglichen Salze zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Pilzen (=Schadpilzen) sowie ein Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, das dadurch gekennzeichnet ist, dass man die Pilze, oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen
- 20 Menge einer Verbindung der allgemeinen Formel I, einem Tautomer von I und/oder mit einem landwirtschaftlich verträglichen Salz von I oder dessen Tautomer behandelt.

- Gegenstand der vorliegenden Erfindung Mittel zur Bekämpfung von Schadpilzen, enthaltend wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel I, ein Tautomer von I
- 25 und/oder ein landwirtschaftlich verträgliches Salz davon oder von dessen Tautomer und wenigstens einen flüssigen oder festen Trägerstoff.

- Die Verbindungen der Formel I und deren Tautomere können je nach Substitutionsmuster ein oder mehrere Chiralitätszentren aufweisen und liegen dann als Enantiomeren- oder Diastereomere
- 30 mengen vor. Gegenstand der Erfindung sind sowohl die reinen Enantiomere oder Diastereomere als auch deren Gemische.

Unter landwirtschaftlich brauchbaren Salzen kommen vor allem die Salze derjenigen Kationen oder die Säureadditionssalze derjenigen Säuren in Betracht, deren Kationen

M/45025

beziehungsweise Anionen die fungizide Wirkung der Verbindungen I nicht negativ beeinträchtigen. So kommen als Kationen insbesondere die Ionen der Alkalimetalle, vorzugsweise Natrium und Kalium, der Erdalkalimetalle, vorzugsweise Calcium, Magnesium und Barium, und der Übergangsmetalle, vorzugsweise Mangan, Kupfer, Zink und Eisen, sowie das Ammoniumion, das gewünschtenfalls ein bis vier C₁-C₄-Alkylsubstituenten und/oder einen Phenyl- oder Benzylsubstituenten tragen kann, vorzugsweise Diisopropylammonium, Tetramethylammonium, Tetrabutylammonium, Trimethylbenzylammonium, des weiteren Phosphoniumionen, Sulfoniumionen, vorzugsweise Tri(C₁-C₄-alkyl)sulfonium und Sulfoxoniumionen, vorzugsweise Tri(C₁-C₄-alkyl)sulfoxonium, in Betracht.

Anionen von brauchbaren Säureadditionssalzen sind in erster Linie Chlorid, Bromid, Fluorid, Hydrogensulfat, Sulfat, Dihydrogenphosphat, Hydrogenphosphat, Phosphat, Nitrat, Hydrogencarbonat, Carbonat, Hexafluorosilikat, Hexafluorophosphat, Benzoat, sowie die Anionen von C₁-C₄-Alkansäuren, vorzugsweise Formiat, Acetat, Propionat und Butyrat. Sie können durch Reaktion von I mit einer Säure des entsprechenden Anions, vorzugsweise der Chlorwasserstoffsäure, Bromwasserstoffsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure oder Salpetersäure, gebildet werden.

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Variablen werden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die jeweiligen Substituenten stehen. Die Bedeutung C_n-C_m gibt die jeweils mögliche Anzahl von Kohlenstoffatomen in dem jeweiligen Substituenten oder Substituententeil an:

Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

Alkyl sowie alle Alkylteile in Alkoxy, Alkylthio, Alkoxyalkyl, Alkoxyalkoxy, Alkylamino und Dialkylamino: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, bis 6, bis 8 oder bis 10 Kohlenstoffatomen, z.B. C₁-C₆-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

Halo(gen)alkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 4 oder bis 6 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt

sein können, z.B. C₁-C₂-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl und 1,1,1-Trifluorprop-2-yl;

Alkenyl: einfach ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, bis 6 bis 8 oder bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position, z.B. C₂-C₆-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1-propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

Alkadienyl: zweifach ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 4 bis 10 Kohlenstoffatomen und zwei Doppelbindungen in einer beliebigen Position z.B. 1,3-Butadienyl, 1-Methyl-1,3-butadienyl, 2-Methyl-1,3-butadienyl, Penta-1,3-dien-1-yl, Hexa-1,4-dien-1-yl, Hexa-1,4-dien-3-yl, Hexa-1,4-dien-6-yl, Hexa-1,5-dien-1-yl, Hexa-1,5-dien-3-yl, Hexa-1,5-dien-4-yl, Hepta-1,4-dien-1-yl, Hepta-1,4-dien-3-yl, Hepta-1,4-dien-6-yl, Hepta-1,4-dien-7-yl, Hepta-1,5-dien-1-yl, Hepta-1,5-dien-3-yl, Hepta-1,5-dien-4-yl, Hepta-1,5-dien-7-yl, Hepta-1,6-dien-1-yl, Hepta-1,6-dien-3-yl, Hepta-1,6-dien-4-yl, Hepta-1,6-dien-5-yl, Hepta-1,6-dien-2-yl, Octa-1,4-dien-1-yl, Octa-1,4-dien-2-yl, Octa-1,4-dien-3-yl, Octa-1,4-dien-6-yl, Octa-1,4-dien-7-yl, Octa-1,5-dien-1-yl, Octa-1,5-dien-3-yl, Octa-1,5-dien-4-yl, Octa-1,5-dien-7-yl, Octa-1,6-dien-1-yl, Octa-1,6-dien-3-yl, Octa-1,6-dien-4-yl, Octa-1,6-dien-5-yl, Octa-1,6-dien-2-yl, Deca-1,4-dienyl, Deca-1,5-dienyl, Deca-1,6-dienyl, Deca-1,7-dienyl, Deca-1,8-dienyl, Deca-2,5-

dienyl, Deca-2,6-dienyl, Deca-2,7-dienyl, Deca-2,8-dienyl und dergleichen;

Alkynyl: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 4, 2 bis 6 2 bis 8 oder 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position, z.B. C₂-C₆-Alkynyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

Cycloalkyl: monocyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 8, vorzugsweise bis 6 Kohlenstoffringgliedern, wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl;

Cycloalkenyl: monocyclische, einfach ungesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 5 bis 8, vorzugsweise bis 6 Kohlenstoffringgliedern, wie Cyclopenten-1-yl, Cyclopenten-3-yl, Cyclohexen-1-yl, Cyclohexen-3-yl und Cyclohexen-4-yl;

Bicycloalkyl: bicyclischer Kohlenwasserstoffrest mit 5 bis 10 C-Atomen wie Bicyclo[2.2.1]hept-1-yl, Bicyclo[2.2.1]hept-2-yl, Bicyclo[2.2.1]hept-7-yl, Bicyclo[2.2.2]oct-1-yl, Bicyclo[2.2.2]oct-2-yl, Bicyclo[3.3.0]octyl und Bicyclo[4.4.0]decyl.

Alkylamino für einen über eine NH-Gruppe geordnete Alkylgruppe wie Methylamino, Ethylamino, n-Propylamino, Isopropylamino, n-Butylamino und dergleichen;

Dialkylamino für einen Rest der Formel N(Alkyl)₂, worin Alkyl für einen der zuvor genannten Alkylreste mit in der Regel 1 bis 6 und insbesondere 1 bis 4 C-Atomen steht, z.B. für Dimethylamino, Diethylamino, Methylethylamino, N-Methyl-N-propylamino und dergleichen.

C₁-C₄-Alkoxy für eine über ein Sauerstoff gebundene Alkylgruppe mit 1 bis 4 C-Atomen: z. B. Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, 1-Methylethoxy, Butoxy, 1-Methylpropoxy, 2-Methylpropoxy oder 1,1-Dimethylethoxy;

C₁-C₆-Alkoxy: für C₁-C₄-Alkoxy, wie voranstehend genannt, sowie z. B. Pentoxy, 1-Methylbutoxy, 2-Methylbutoxy, 3-Methylbutoxy, 1,1-Dimethylpropoxy, 1,2-

- Dimethylpropoxy, 2,2-Dimethylpropoxy, 1-Ethylpropoxy, Hexoxy, 1-Methylpentoxy, 2-Methylpentoxy, 3-Methylpentoxy, 4-Methylpentoxy, 1,1-Dimethylbutoxy, 1,2-Dimethylbutoxy, 1,3-Dimethylbutoxy, 2,2-Dimethylbutoxy, 2,3-Dimethylbutoxy, 3,3-Dimethylbutoxy, 1-Ethylbutoxy, 2-Ethylbutoxy, 1,1,2-Trimethylpropoxy, 1,2,2-Trimethylpropoxy, 1-Ethyl-1-methylpropoxy oder 1-Ethyl-2-methylpropoxy;

- C₁-C₄-Halogenalkoxy:** für einen C₁-C₄-Alkoxyrest wie vorstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod, vorzugsweise durch Fluor substituiert ist, also z.B. OCH₂F, OCHF₂, OCF₃, OCH₂Cl, OCHCl₂, OCCl₃, Chlorfluormethoxy, Dichlorfluormethoxy, Chlordifluormethoxy, 2-Fluorethoxy, 2-Chlorethoxy, 2-Bromethoxy, 2-Iodethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2-fluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxy, 2,2,2-Trichlorethoxy, OC₂F₅, 2-Fluorpropoxy, 3-Fluorpropoxy, 2,2-Difluorpropoxy, 2,3-Difluorpropoxy, 2-Chlorpropoxy, 3-Chlorpropoxy, 2,3-Dichlorpropoxy, 2-Brompropoxy, 3-Brompropoxy, 3,3,3-Trifluorpropoxy, 3,3,3-Trichlorpropoxy, OCH₂-C₂F₅, OCF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-fluorethoxy, 1-(CH₂Cl)-2-chlorethoxy, 1-(CH₂Br)-2-bromethoxy, 4-Fluorbutoxy, 4-Chlorbutoxy, 4-Brombutoxy oder Nonafluorbutoxy;

- C₁-C₆-Halogenalkoxy:** für C₁-C₄-Halogenalkoxy, wie voranstehend genannt, sowie z.B. 5-Fluorpentoxy, 5-Chlorpentoxy, 5-Brompentoxy, 5-Iodpentoxy, Undecafluorpentoxy, 6-Fluorhexoxy, 6-Chlorhexoxy, 6-Bromhexoxy, 6-Iodhexoxy oder Dodecafluorhexoxy;

- Alkenyloxy:** Alkenyl wie vorstehend genannt, das über ein Sauerstoffatom gebunden ist, z.B. C₂-C₆-Alkenyloxy wie Vinyloxy, 1-Propenyloxy, 2-Propenyloxy, 1-Methylethenyloxy, 1-Butenyloxy, 2-Butenyloxy, 3-Butenyloxy, 1-Methyl-1-propenyloxy, 2-Methyl-1-propenyloxy, 1-Methyl-2-propenyloxy, 2-Methyl-2-propenyloxy, 1-Pentenyloxy, 2-Pentenyloxy, 3-Pentenyloxy, 4-Pentenyloxy, 1-Methyl-1-butenyloxy, 2-Methyl-1-butenyloxy, 3-Methyl-1-butenyloxy, 1-Methyl-2-butenyloxy, 2-Methyl-2-butenyloxy, 3-Methyl-2-butenyloxy, 1-Methyl-3-butenyloxy, 2-Methyl-3-butenyloxy, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyloxy, 1,2-Dimethyl-1-propenyloxy, 1,2-Dimethyl-2-propenyloxy, 1-Ethyl-1-propenyloxy, 1-Ethyl-2-propenyloxy, 1-Hexenyloxy, 2-Hexenyloxy, 3-Hexenyloxy, 4-Hexenyloxy, 5-Hexenyloxy, 1-Methyl-1-pentenyloxy, 2-Methyl-1-pentenyloxy, 3-Methyl-1-pentenyloxy, 4-Methyl-1-pentenyloxy, 1-Methyl-2-pentenyloxy, 2-Methyl-2-pentenyloxy, 3-Methyl-2-pentenyloxy, 4-Methyl-2-pentenyloxy, 1-Methyl-3-pentenyloxy, 2-Methyl-3-pentenyloxy, 3-Methyl-3-pentenyloxy, 4-Methyl-3-pentenyloxy, 1-Methyl-4-pentenyloxy, 2-Methyl-4-pentenyloxy, 3-Methyl-4-pentenyloxy, 4-Methyl-4-pentenyloxy, 1,1-Dimethyl-2-butenyloxy, 1,1-Dimethyl-3-butenyloxy, 1,2-Dimethyl-1-butenyloxy, 1,2-Dimethyl-2-butenyloxy, 1,2-Dimethyl-3-butenyloxy, 1,3-Dimethyl-1-butenyloxy, 1,3-Dimethyl-2-butenyloxy, 1,3-Dimethyl-3-butenyloxy, 2,2-

Dimethyl-3-butenyloxy, 2,3-Dimethyl-1-butenyloxy, 2,3-Dimethyl-2-butenyloxy, 2,3-Dimethyl-3-butenyloxy, 3,3-Dimethyl-1-butenyloxy, 3,3-Dimethyl-2-butenyloxy, 1-Ethyl-1-butenyloxy, 1-Ethyl-2-butenyloxy, 1-Ethyl-3-butenyloxy, 2-Ethyl-1-butenyloxy, 2-Ethyl-2-butenyloxy, 2-Ethyl-3-butenyloxy, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyloxy, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyloxy, 1-Ethyl-2-methyl-1propenyloxy und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyloxy;

Alkinyloxy: Alkynyl wie vorstehend genannt, das über ein Sauerstoffatom gebunden ist, z.B. C₃-C₆-Alkinyloxy wie 2-Propinyloxy, 2-Butinyloxy, 3-Butinyloxy, 1-Methyl-2-propinyloxy, 2-Pentinyloxy, 3-Pentinyloxy, 4-Pentinyloxy, 1-Methyl-2-butinyloxy, 1-Methyl-3-butinyloxy, 2-Methyl-3-butinyloxy, 1-Ethyl-2-propinyloxy, 2-Hexinyloxy, 3-Hexinyloxy, 4-Hexinyloxy, 5-Hexinyloxy, 1-Methyl-2-pentinyloxy, 1-Methyl-3-pentinyloxy und dergleichen;

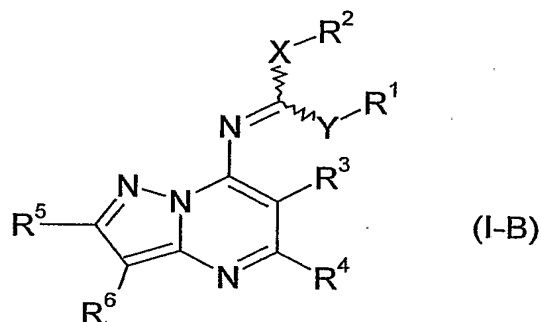
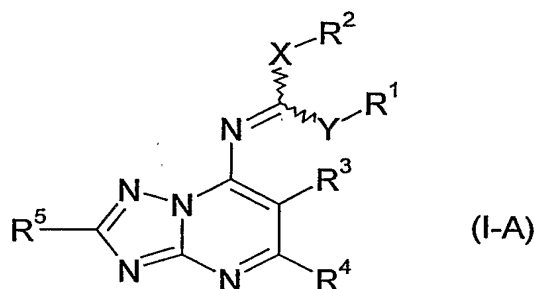
fünf- oder sechsgliedriger gesättigter oder partiell ungesättigter Heterocyclus, enthaltend ein, zwei, drei oder vier Heteroatome aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel als Ringglieder: z.B. mono- und bicyclische Heterocyclen (Heterocyclyl) enthaltend neben Kohlenstoffringgliedern ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isioxazolidinyl, 4-Isioxazolidinyl, 5-Isioxazolidinyl, 3-Isiothiazolidinyl, 4-Isiothiazolidinyl, 5-Isiothiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 1,2,4-Oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Triazolidin-3-yl, 1,3,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Triazolidin-2-yl, 2,3-Dihydrofur-2-yl, 2,3-Dihydrofur-3-yl, 2,4-Dihydrofur-2-yl, 2,4-Dihydrofur-3-yl, 2,3-Dihydrothien-2-yl, 2,3-Dihydrothien-3-yl, 2,4-Dihydrothien-2-yl, 2,4-Dihydrothien-3-yl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Isioxazolin-3-yl, 3-Isioxazolin-3-yl, 4-Isioxazolin-3-yl, 2-Isioxazolin-4-yl, 3-Isioxazolin-4-yl, 4-Isioxazolin-4-yl, 2-Isioxazolin-5-yl, 3-Isioxazolin-5-yl, 4-Isioxazolin-5-yl, 2-Isiothiazolin-3-yl, 3-Isiothiazolin-3-yl, 4-Isiothiazolin-3-yl, 2-Isiothiazolin-4-yl, 3-Isiothiazolin-4-yl, 4-Isiothiazolin-4-yl, 2-Isiothiazolin-5-yl, 3-Isiothiazolin-5-yl, 4-Isiothiazolin-5-yl, 2,3-Dihydropyrazol-1-yl, 2,3-Dihydropyrazol-2-yl, 2,3-Dihydropyrazol-3-yl, 2,3-Dihydropyrazol-4-yl, 2,3-Dihydropyrazol-5-yl, 3,4-Dihydropyrazol-1-yl, 3,4-Dihydropyrazol-3-yl, 3,4-Dihydropyrazol-4-yl, 3,4-Dihydropyrazol-5-yl, 4,5-Dihydropyrazol-1-yl, 4,5-Dihydropyrazol-3-yl, 4,5-Dihydropyrazol-4-yl, 4,5-Dihydropyrazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 2,3-Dihydrooxazol-3-yl, 2,3-Dihydrooxazol-4-yl, 2,3-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 3,4-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-

3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydropyrimidinyl, 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl, 2-Piperazinyl, 1,3,5-Hexahydro-triazin-2-yl und 1,2,4-Hexahydrotriazin-3-yl sowie die entsprechenden -yliden-Reste;

siebengliedriger gesättigter oder partiell ungesättigter Heterocyclus, enthaltend ein, zwei, drei oder vier Heteroatome aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel als Ringglieder: z.B. mono- und bicyclische Heterocyclusen mit 7 Ringgliedern, enthaltend neben Kohlenstoffringgliedern ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, beispielsweise Tetra- und Hexahydroazepinyl wie 2,3,4,5-Tetrahydro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- oder -7-yl, 3,4,5,6-Tetrahydro[2H]azepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- oder -7-yl, 2,3,4,7-Tetrahydro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- oder -7-yl, 2,3,6,7-Tetrahydro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- oder -7-yl, Hexahydroazepin-1-, -2-, -3- oder -4-yl, Tetra- und Hexahydrooxepinyl wie 2,3,4,5-Tetrahydro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- oder -7-yl, 2,3,4,7-Tetrahydro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- oder -7-yl, 2,3,6,7-Tetrahydro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- oder -7-yl, Hexahydroazepin-1-, -2-, -3- oder -4-yl, Tetra- und Hexahydro-1,3-diazepinyl, Tetra- und Hexahydro-1,4-diazepinyl, Tetra- und Hexahydro-1,3-oxazepinyl, Tetra- und Hexahydro-1,4-oxazepinyl, Tetra- und Hexahydro-1,3-dioxepinyl, Tetra- und Hexahydro-1,4-dioxepinyl und die entsprechenden yliden-Reste.

fünf- bis sechsgliedriger aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein, zwei, drei oder vier Heteroatome aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff oder Schwefel: ein- oder zweikerniges Heteroaryl, z.B. C-gebundenes 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome oder ein oder zwei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder wie 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Isotiazolyl, 4-Isotiazolyl, 5-Isotiazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl und 1,3,4-Triazol-2-yl; über Stickstoff gebundenes 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome als Ringglieder wie Pyrrol-1-yl, Pyrazol-1-yl, Imidazol-1-yl, 1,2,3-Triazol-1-yl und 1,2,4-Triazol-1-yl; 6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome ein bis drei Stickstoffatome als Ringglieder wie Pyridin-2-yl, Pyridin-3-yl, Pyridin-4-yl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl;

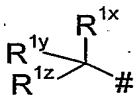
Eine erste Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin A für N steht. Derartige Verbindungen werden im Folgenden auch als Verbindungen I-A bezeichnet. Eine zweite Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin A für C-R⁶ steht. Derartige Verbindungen werden im Folgenden auch als Verbindungen I-B bezeichnet.



Im Hinblick auf die fungizide Wirkung der erfindungsgemäßen Verbindungen sind solche Verbindung der Formel I bevorzugt, worin A, R¹, R², R³, R⁴ und R⁵ insbesondere die im Folgenden angegebenen Bedeutungen aufweisen:

R¹ und R² stehen unabhängig voneinander für C₁-C₁₀-Alkyl, C₁-C₁₀-Haloalkyl, C₃-C₁₀-Alkenyl, C₃-C₁₀-Haloalkenyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₈-Cycloalkenyl, C₃-C₈-Cyclo-C₁-C₁₀-alkyl, C₃-C₈-Cyclo-C₁-C₁₀-alkenyl, Phenyl oder Benzyl wobei die 6 letztgenannten Reste auch 1, 2, 3 oder 4 Substituenten, ausgewählt unter Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl und C₁-C₄-Alkoxy tragen können, oder eine Gruppe X-R² oder Y-R¹ steht für Wasserstoff oder Halogen, speziell Chlor und der verbleibende Rest R² bzw. R¹ weist die hier als bevorzugt angegebenen Bedeutungen auf.

Im Folgenden werden bevorzugte Gruppen R¹ und R² näher erläutert. Die im Folgenden für R¹ gemachten Angaben gelten entsprechend auch für R². R¹ steht vorzugsweise für C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl oder C₁-C₈-Halogenalkyl steht. Sofern R¹ für eine Alkenyl- oder Alkynylgruppe steht, kann diese am α-C-Atom eine Verzweigung aufweisen. In diesen Fällen entspricht die Gruppe R¹ einer Gruppe A:



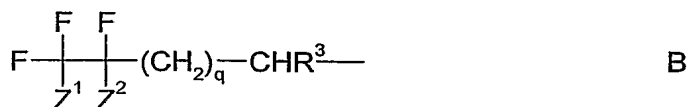
A

in der # die Bindung zu dem Kohlenstoffatom der Iminogruppe darstellt und
 R^{1x} C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Halogenalkyl;
 R^{1y} Wasserstoff, C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Halogenalkyl;

R^{1z} C_2 - C_{10} -Alkenyl oder C_2 - C_8 -Alkynyl, wobei R^{1z} unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein und/oder eine bis drei Gruppen R^8 tragen kann; bedeuten.

- 5 Gleichmaßen bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R^1 für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder aromatischen Heterocyclus, enthaltend ein oder zwei Heteroatome aus der Gruppe N, O und S steht, der durch eine oder zwei Alkyl- oder Halogenalkylgruppen substituiert sein kann.

- 10 Verbindungen I sind bevorzugt, in denen R^1 für eine Gruppe B steht:



worin

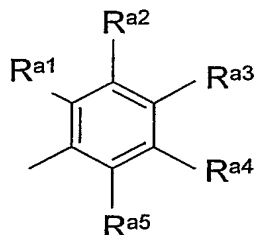
- 15 Z^1 Wasserstoff, Fluor oder C_1 - C_6 -Fluoroalkyl,
 Z^2 Wasserstoff oder Fluor, oder
 Z^1 und Z^2 bilden gemeinsam eine Doppelbindung;
 q 0 oder 1 ist; und
 R^3 Wasserstoff oder Methyl bedeuten.

- 20 Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^1 für C_3 - C_6 -Cycloalkyl steht, welches durch C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein kann.

- 25 Wenn $X-R^1$ mit $Y-R^2$ und dem C-Atom, an das sie gebunden sind einen gegebenenfalls substituierten Carbo- oder Heterocyclus bildet, dann ist dieser Cyclus vorzugsweise ausgewählt unter 5-, 6- oder 7-gliedrigen gesättigten oder einfach ungesättigten Cyclen, die gegebenenfalls ein Heteroatom als Ringglied umfassen. Beispielsweise stehen dann $X-R^1$ mit $Y-R^2$ gemeinsam für $-(\text{CH}_2)_2\text{CH}=\text{CHCH}_2-$, $-(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHCH}_2-$, $-(\text{CH}_2)_2\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_2-$, $-(\text{CH}_2)_2\text{CHF}(\text{CH}_2)_2-$, $-(\text{CH}_2)_3\text{CHFCH}_2-$, $-(\text{CH}_2)_2\text{CH}(\text{CF}_3)(\text{CH}_2)_2-$, $-(\text{CH}_2)_2\text{O}(\text{CH}_2)_2-$, $-(\text{CH}_2)_2\text{S}(\text{CH}_2)_2-$, $-(\text{CH}_2)_5-$, $-(\text{CH}_2)_6-$, $-(\text{CH}_2)_4-$, $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2-$,
 30 $-\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_3-$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_4-$, $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_2-$ oder $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_3-$.

- Unter den Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin solche bevorzugt, worin R^3 für einen Phenyl-Ring steht, der 1, 2, 3 oder 4, insbesondere 1, 2 oder 3 der zuvor angegebenen Reste R^9 aufweist. Vorzugsweise ist wenigstens einer der Reste R^9 in der ortho-Position zur Bindungsstelle angeordnet. R^9 ist dann insbesondere unter den folgenden Resten ausgewählt: Halogen, speziell Fluor oder Chlor, CN, C_1 - C_4 -Alkyl, speziell Methyl oder Ethyl, C_1 -Halogenalkyl, speziell Trifluormethyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, speziell Methoxy oder $-\text{C}(=\text{O})-\text{R}^{13}$, worin R^{13} die zuvor angegebenen Bedeutungen auf-

weist und insbesondere für Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₂-Alkylamino oder Di-C₁-C₂-alkylamino steht. Hierunter sind solche Verbindungen der allgemeinen Formel I bevorzugt, worin R³ für eine Gruppe der Formel



5

steht, worin

- 10 R^{a1} für Fluor, Chlor, Methyl oder CF₃;
 R^{a2} für Wasserstoff, Chlor oder Fluor;
 R^{a3} für Wasserstoff, CN, NO₂, Fluor, Chlor, C₁-C₄-Alkyl, speziell Methyl, eine Gruppe C(W)R^{13a}, worin W für Sauerstoff oder Schwefel steht und R^{13a} für C₁-C₄-Alkoxy, NH₂, C₁-C₄-Alkylamino oder Di-C₁-C₄-alkylamino steht, speziell C(O)OCH₃, CONH₂, C(S)OCH₃, oder C₁-C₄-Alkoxy, speziell Methoxy;
 15 R^{a4} für Wasserstoff, Chlor oder Fluor;
 R^{a5} für Wasserstoff, Fluor, Chlor oder C₁-C₄-Alkyl stehen.

- Wenn R³ für einen von Phenyl verschiedenen Rest steht, dann steht R³ vorzugsweise für einen gegebenenfalls substituierten Kohlenwasserstoffrest mit 3 bis 8 C-Atomen, und insbesondere für gegebenenfalls substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkylmethyl, C₃-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Haloalkyl oder Benzyl und beispielsweise für Propyl, Isopropyl, Isobutyl, 1-Methylbutyl, tert. Butyl, n-Octyl, Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, 2,2,2-Trifluorethyl, Benzyl oder 2-, 3- oder 4-Chlorphenylmethyl.
- 25 Weiterhin hat es sich als vorteilhaft erwiesen, wenn R⁴ in Formel I für Halogen, CN oder C₁-C₄-Alkyl, speziell Methyl, steht. Hierunter sind insbesondere Verbindungen der allgemeinen Formel I bevorzugt, worin R⁴ für Halogen steht. Bevorzugt sind auch Verbindungen der Formel I, worin R⁴ für Methyl steht.
- 30 Unter den Verbindungen der allgemeinen Formel I sind weiterhin solche Verbindungen bevorzugt, worin R⁵ für Wasserstoff, Halogen, speziell Chlor oder Fluor, oder für C₁-C₄-Alkyl, speziell Methyl steht. In einer Besonders bevorzugten Ausführungsform steht R⁵ für Wasserstoff.

15

In den Verbindungen der allgemeinen Formel I-B steht R^6 vorzugsweise für Wasserstoff, Halogen, speziell Chlor oder Fluor, eine Gruppe $C(W)R^{13a}$, worin W für Sauerstoff oder Schwefel steht und R^{13a} für C_1 - C_4 -Alkoxy, NH_2 , C_1 - C_4 -Alkylamino oder Di- C_1 - C_4 -alkylamino steht, speziell $C(O)OCH_3$, $CONH_2$, $C(S)OCH_3$, oder für C_1 - C_4 -Alkyl, speziell Methyl. Sofern R^5 von Wasserstoff verschieden ist steht R^6 insbesondere für Wasserstoff. Besonders bevorzugt stehen in Formel I-B R^5 und R^6 für Wasserstoff.

In einer bevorzugten Ausführungsform der erfindungsgemäßen Verbindungen steht wenigstens eine der Variablen X oder Y in Formel I für eine chemische Bindung. Hierunter sind solche Verbindungen bevorzugt, worin eine der Gruppen $Y-R^1$ oder $X-R^2$ für Wasserstoff oder C_1 - C_8 -Alkyl und speziell C_1 - C_4 -Alkyl steht. Die andere dieser Gruppen $Y-R^1$ oder $X-R^2$ weist die zuvor angegebenen Bedeutungen auf. Insbesondere weisen dann R^1 und R^2 eine der als bevorzugt angegebenen Bedeutungen auf.

In einer besonders bevorzugten Ausführungsform der Verbindungen I stehen beide Variablen X und Y für eine chemische Bindung. R^1 und R^2 haben dann unabhängig voneinander die zuvor angegebenen Bedeutungen und sind insbesondere ausgewählt unter Wasserstoff, C_1 - C_{10} -Alkyl C_1 - C_{10} -Haloalkyl, C_3 - C_{10} -Alkenyl, C_3 - C_{10} -Haloalkenyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkenyl, C_3 - C_8 -Cyclo- C_1 - C_{10} -alkyl, C_3 - C_8 -Cyclo- C_1 - C_{10} -alkenyl, Phenyl oder Benzyl wobei die 6 letztgenannten Reste auch 1, 2, 3 oder 4 Substituenten, ausgewählt unter Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl und C_1 - C_4 -Alkoxy tragen können, wobei einer der Reste R^1 oder R^2 auch für Halogen und speziell Chlor stehen kann. Hierunter sind solche Verbindungen besonders bevorzugt, worin einer der Reste R^1 oder R^2 für eine Gruppe der Formel A oder B wie vorstehend definiert steht.

Unter den Verbindungen I, worin X und Y jeweils für eine chemische Bindung stehen, sind solche Verbindungen bevorzugt, worin einer der Variablen R^1 oder R^2 für Wasserstoff oder C_1 - C_4 -Alkyl steht und die andere Variable eine zuvor genannte, und insbesondere eine als bevorzugt genannte Bedeutung aufweist.

Unter den Verbindungen I, worin X und Y jeweils für eine chemische Bindung stehen, sind außerdem solche Verbindungen bevorzugt, worin einer der Variablen R^1 oder R^2 für Halogen, speziell für Chlor steht und die andere Variable eine zuvor genannte, und insbesondere eine als bevorzugt genannte Bedeutung aufweist.

R^7 steht insbesondere für Wasserstoff oder C_1 - C_4 -Alkyl. Verbindungen mit R^7 = Wasserstoff können insbesondere auch in Form von Tautomeren der Formel II vorliegen, worin, W^a für eine Gruppe $NH-R^{21}$ steht.

16

R⁸ steht insbesondere für Halogen, speziell Fluor, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkyl.

5 In den Gruppen OR¹⁰, SR¹⁰, NR¹¹R¹², C(W)R¹³, C(=N-OR¹⁵)R¹⁴, NHC(W)R¹⁶, C(W)R¹⁷ und NR¹⁸R¹⁹ haben die Variablen insbesondere die im Folgenden angegebenen Bedeutungen:

10 R¹⁰ steht insbesondere für H, C₁-C₄-Alkyl, C(O)H oder C₁-C₄-Alkylcarbonyl. OR¹⁰ steht insbesondere für OH, C₁-C₄-Alkoxy, O-C(O)H oder C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy. OR¹⁰ steht insbesondere für SH oder S-C₁-C₄-Alkyl.

R¹¹ und R¹² stehen insbesondere für H, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl oder C₁-C₄-Alkyl(thiocarbonyl). Insbesondere steht NR¹¹R¹² für NH₂, NHCH₃, NHC₂H₅, N(CH₃)₂, N(C₂H₅)CH₃, NHC(O)CH₃ oder NHC(O)H.

15 R¹³ steht insbesondere für H, C₁-C₄-Alkyl, OH, NH₂, NHCH₃, NHC₂H₅, N(CH₃)₂, N(C₂H₅)CH₃ oder C₁-C₄-Alkoxy.

R¹⁴ steht insbesondere für C₁-C₄-Alkyl.

20 R¹⁵ steht insbesondere für C₁-C₄-Alkyl.

R¹⁶ steht insbesondere für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl.

25 R¹⁷ steht insbesondere für H, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy.

R¹⁸ und R¹⁹ stehen insbesondere für H, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl oder C₁-C₄-Alkyl(thiocarbonyl). Insbesondere steht NR¹⁸R¹⁹ für NH₂, NHCH₃, NHC₂H₅, N(CH₃)₂, N(C₂H₅)CH₃, NHC(O)CH₃ oder NHC(O)H.

30 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R³ für 2-Fluor-6-chlorphenyl steht, R⁴ für Chlor steht, R⁵ Wasserstoff bedeutet und X, Y, R¹ und R² die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A1). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A1.1 bis I-A1.349, worin X-R² und Y-R¹
35 gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R³ für 2,6-Difluorphenyl steht, R⁴
40 für Chlor steht, R⁵ Wasserstoff bedeutet und X, Y, R¹ und R² die zuvor genannten und

insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A2). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A2.1 bis I-A2.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,6-Dichlorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A3). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A3.1 bis I-A3.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

10

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Fluor-6-methylphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A4). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A4.1 bis I-A4.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

15

20

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,4,6-Trifluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A5). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A5.1 bis I-A5.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

25

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,6-Difluor-4-methoxyphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A6). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A6.1 bis I-A6.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

30

35

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Fluor-6-chlorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und

40

insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A7). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A7.1 bis I-A7.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolo-pyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für Pentafluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A8). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A8.1 bis I-A8.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

10

15

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolo-pyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Methyl-4-fluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A9). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A9.1 bis I-A9.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

20

25

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolo-pyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Trifluormethylphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A10). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A10.1 bis I-A10.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

30

35

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolo-pyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Methoxy-6-fluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A11). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A11.1 bis I-A11.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

40

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolo-pyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Chlorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbe-

sondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A12). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A12.1 bis I-A12.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Fluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A13).

10 Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A13.1 bis I-A13.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

15

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,4-Difluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A14). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A14.1 bis I-A14.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

20

25

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Fluor-4-chlorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A15). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A15.1 bis I-A15.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

30

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 4-Fluor-6-chlorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A16). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A16.1 bis I-A16.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

35

40

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,3-Difluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und

insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A17). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A17.1 bis I-A17.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolo-pyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,5-Difluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A18). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A18.1 bis I-A18.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

10

15

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolo-pyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,3,4-Trifluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A19). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A19.1 bis I-A19.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

20

25

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolo-pyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Methylphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A20). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A20.1 bis I-A20.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

30

35

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolo-pyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,4-Dimethylphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A21). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A21.1 bis I-A21.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

40

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolo-pyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Methyl-4-chlorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und

insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A22). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A22.1 bis I-A22.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolo-pyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Fluor-4-methylphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A23). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A23.1 bis I-A23.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

10

15

20

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolo-pyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,6-Dimethylphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A24). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A24.1 bis I-A24.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

25

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolo-pyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,4,5-Trimethylphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A25). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A25.1 bis I-A25.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

30

35

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolo-pyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,6-Difluor-4-cyanophenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A26). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A26.1 bis I-A26.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

40

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolo-pyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,6-Difluor-4-methylphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten

und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A27). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A27.1 bis I-A27.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,6-Difluor-4-methoxycarbonylphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A28). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A28.1 bis I-A28.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

10

15

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Trifluormethyl-4-fluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-Azb). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A29.1 bis I-A29.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

20

25

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Trifluormethyl-5-fluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A30). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A30.1 bis I-A30.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

30

35

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Trifluormethyl-5-chlorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A31). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A31.1 bis I-A31.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

40

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Fluor-6-chlorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und

insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A32). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A32.1 bis I-A32.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,6-Difluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A33). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A33.1 bis I-A33.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

10

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,6-Dichlorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A34). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A34.1 bis I-A34.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

15

20

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Fluor-6-methylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A35). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A35.1 bis I-A35.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

25

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,4,6-Trifluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A36). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A36.1 bis I-A36.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

30

35

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,6-Difluor-4-methoxyphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten

40

und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A37). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A37.1 bis I-A37.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Fluor-6-chlorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A38). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A38.1 bis I-A38.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

10

15

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für Pentafluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A39). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A39.1 bis I-A39.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

20

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Methyl-4-fluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A40). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A40.1 bis I-A40.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

25

30

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Trifluormethylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A41). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A41.1 bis I-A41.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

35

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Methoxy-6-fluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten

40

und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A42). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A42.1 bis I-A42.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolo-pyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Chlorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A43).

10 Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A43.1 bis I-A43.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

15

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolo-pyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Fluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A44). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A44.1 bis I-A44.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

20

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolo-pyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,4-Difluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A45). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A45.1 bis I-A45.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

25

30 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolo-pyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Fluor-4-chlorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A46). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A46.1 bis I-A46.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

35

40 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolo-pyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 4-Fluor-6-chlorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und

insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A47). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A47.1 bis I-A47.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,3-Difluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A48). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A48.1 bis I-A48.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

10

15

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,5-Difluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A49). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A49.1 bis I-A49.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

20

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,3,4-Trifluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A50). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A50.1 bis I-A50.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

25

30

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Methylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-As). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A51.1 bis I-A51.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

35

40

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,4-Dimethylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und

insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A51). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A51.1 bis I-A51.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolo-pyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Methyl-4-chlorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindun-

10

gen I-A52). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A52.1 bis I-A52.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutun-

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolo-pyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Fluor-4-methylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindun-

15

gen I-A53). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A53.1 bis I-A53.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutun-

20

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolo-pyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,6-Dimethylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-

25

A54). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A54.1 bis I-A54.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen auf-

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolo-pyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,4,5-Trimethylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-

30

A55). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A55.1 bis I-A55.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

35

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolo-pyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,6-Difluor-4-cyanophenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten

40

und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A56). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A56.1 bis I-A56.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,6-Difluor-4-methylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A57). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A57.1 bis I-A57.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

10

15

20

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2,6-Difluor-4-methoxycarbonylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A58). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A58.1 bis I-A58.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

25

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Trifluormethyl-4-fluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A59). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A59.1 bis I-A59.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

30

35

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Trifluormethyl-5-fluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A60). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A60.1 bis I-A60.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

40

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-A, worin R^3 für 2-Trifluormethyl-5-chlorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor ge-

nannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-A61). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-A61.1 bis I-A61.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Fluor-6-chlorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B1). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B1.1 bis I-B1.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

10

15

20

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2,6-Difluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B2). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B2.1 bis I-B2.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

25

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2,6-Dichlorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B3). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B3.1 bis I-B3.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

30

35

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Fluor-6-methylphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B4). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B4.1 bis I-B4.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

40

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2,4,6-Trifluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und

insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B5). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B5.1 bis I-B5.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2,6-Difluor-4-methoxyphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B6). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B6.1 bis I-B6.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

10

15

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Fluor-6-chlorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B7). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B7.1 bis I-B7.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

20

25

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für Pentafluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B8). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B8.1 bis I-B8.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

30

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Methyl-4-fluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B9). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B9.1 bis I-B9.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

35

40

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Trifluormethylphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und

insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B10). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B10.1 bis I-B10.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Methoxy-6-fluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B11). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B11.1 bis I-B11.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

10

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Chlorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B12). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B12.1 bis I-B12.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

20

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Fluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B13). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B13.1 bis I-B13.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

25

30

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2,4-Difluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B14). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B14.1 bis I-B14.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

35

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Fluor-4-chlorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und

40

insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B15). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B15.1 bis I-B15.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 4-Fluor-6-chlorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B16). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B16.1 bis I-B16.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

10

15

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2,3-Difluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B17). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B17.1 bis I-B17.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

20

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2,5-Difluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B18). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B18.1 bis I-B18.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

25

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2,3,4-Trifluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B19). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B19.1 bis I-B19.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

30

35

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Methylphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und

40

insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B20). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B20.1 bis I-B20.349, worin X-R² und Y-R¹ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R³ für 2,4-Dimethylphenyl steht, R⁴ für Chlor steht, R⁵ Wasserstoff bedeutet und X, Y, R¹ und R² die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B21). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B21.1 bis I-B21.349, worin X-R² und Y-R¹ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

10

15

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R³ für 2-Methyl-4-chlorphenyl steht, R⁴ für Chlor steht, R⁵ Wasserstoff bedeutet und X, Y, R¹ und R² die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B22). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B22.1 bis I-B22.349, worin X-R² und Y-R¹ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

20

25

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R³ für 2-Fluor-4-methylphenyl steht, R⁴ für Chlor steht, R⁵ Wasserstoff bedeutet und X, Y, R¹ und R² die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B23). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B23.1 bis I-B23.349, worin X-R² und Y-R¹ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

30

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R³ für 2,6-Dimethylphenyl steht, R⁴ für Chlor steht, R⁵ Wasserstoff bedeutet und X, Y, R¹ und R² die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B24). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B24.1 bis I-B24.349, worin X-R² und Y-R¹ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

35

40

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R³ für 2,4,5-Trimethylphenyl steht, R⁴ für Chlor steht, R⁵ Wasserstoff bedeutet und X, Y, R¹ und R² die zuvor genannten und

insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B25). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B25.1 bis I-B25.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2,6-Difluor-4-cyanophenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B26). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B26.1 bis I-B26.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

10

15

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2,6-Difluor-4-methylphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B27). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B27.1 bis I-B27.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

20

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2,6-Difluor-4-methoxycarbonylphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B28). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B28.1 bis I-B28.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

25

30

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Trifluormethyl-4-fluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B29). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B29.1 bis I-B29.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

35

40

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Trifluormethyl-5-fluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor ge-

nannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B30). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B30.1 bis I-B30.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Trifluormethyl-5-chlorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B31). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B31.1 bis I-B31.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

10

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Fluor-6-chlorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B32). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B32.1 bis I-B32.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

15

20

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2,6-Difluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B33). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B33.1 bis I-B33.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

25

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2,6-Dichlorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B34). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B34.1 bis I-B34.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

30

35

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Fluor-6-methylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten

40

und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B35). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B35.1 bis I-B35.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2,4,6-Trifluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B36). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B36.1 bis I-B36.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

10

15

20

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2,6-Difluor-4-methoxyphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B37). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B37.1 bis I-B37.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

25

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Fluor-6-chlorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B38). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B38.1 bis I-B38.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

30

35

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für Pentafluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B39). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B39.1 bis I-B39.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

40

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Methyl-4-fluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten

und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B40). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B40.1 bis I-B40.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Trifluormethylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B41). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B41.1 bis I-B41.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

10

15

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Methoxy-6-fluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B42). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B42.1 bis I-B42.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

20

25

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Chlorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B43). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B43.1 bis I-B43.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

30

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Fluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B44). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B44.1 bis I-B44.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

35

40

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2,4-Difluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und

insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B45). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B45.1 bis I-B45.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Fluor-4-chlorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B46). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B46.1 bis I-B46.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

10

15

20

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 4-Fluor-6-chlorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B47). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B47.1 bis I-B47.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

25

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2,3-Difluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B48). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B48.1 bis I-B48.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

30

35

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2,5-Difluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B49). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B49.1 bis I-B49.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

40

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2,3,4-Trifluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und

insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B50). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B50.1 bis I-B50.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Methylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-Bs).

10 Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B51.1 bis I-B51.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

15

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2,4-Dimethylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B51). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B51.1 bis I-B51.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

20

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Methyl-4-chlorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B52). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B52.1 bis I-B52.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

25

30 Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Fluor-4-methylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B53). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B53.1 bis I-B53.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

35

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2,6-Dimethylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X , Y , R^1 und R^2 die zuvor genannten und

40

insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B54). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B54.1 bis I-B54.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2,4,5-Trimethylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B55). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B55.1 bis I-B55.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

10

15

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2,6-Difluor-4-cyanophenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B56). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B56.1 bis I-B56.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

20

25

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2,6-Difluor-4-methylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B57). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B57.1 bis I-B57.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

30

35

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2,6-Difluor-4-methoxycarbonylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B58). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B58.1 bis I-B58.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

40

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Trifluormethyl-4-fluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor ge-

nannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B59). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B59.1 bis I-B59.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

5

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Trifluormethyl-5-fluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B60). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B60.1 bis I-B60.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

10

15

Besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind auch die Pyrazolopyrimidine der allgemeinen Formel I-B, worin R^3 für 2-Trifluormethyl-5-chlorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet und X, Y, R^1 und R^2 die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen I-B61). Beispiele hierfür sind die Verbindungen I-B61.1 bis I-B61.349, worin $X-R^2$ und $Y-R^1$ gemeinsam jeweils die in einer Zeile der Tabelle A angegebenen Bedeutungen aufweisen.

20

Tabelle A:

| Nr. | $Y-R^1$ | $X-R^2$ |
|-----|---------------------------------|--|
| 1 | H | H |
| 2 | CH ₃ | H |
| 3 | CH ₃ | CH ₃ |
| 4 | CH ₃ | CH ₂ CH ₃ |
| 5 | CH ₃ | Cl |
| 6 | CH ₃ | OCH ₃ |
| 7 | CH ₃ | OC ₂ H ₅ |
| 8 | CH ₃ | N(CH ₃) ₂ |
| 9 | CH ₃ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 10 | CH ₃ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 11 | CH ₂ CH ₃ | H |
| 12 | CH ₂ CH ₃ | CH ₃ |

| Nr. | Y-R ¹ | X-R ² |
|-----|---|--|
| 13 | CH ₂ CH ₃ | CH ₂ CH ₃ |
| 14 | CH ₂ CH ₃ | Cl |
| 15 | CH ₂ CH ₃ | OCH ₃ |
| 16 | CH ₂ CH ₃ | OC ₂ H ₅ |
| 17 | CH ₂ CH ₃ | N(CH ₃) ₂ |
| 18 | CH ₂ CH ₃ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 19 | CH ₂ CH ₃ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 20 | CH ₂ CF ₃ | H |
| 21 | CH ₂ CF ₃ | CH ₃ |
| 22 | CH ₂ CF ₃ | CH ₂ CH ₃ |
| 23 | CH ₂ CF ₃ | Cl |
| 24 | CH ₂ CF ₃ | OCH ₃ |
| 25 | CH ₂ CF ₃ | OC ₂ H ₅ |
| 26 | CH ₂ CF ₃ | N(CH ₃) ₂ |
| 27 | CH ₂ CF ₃ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 28 | CH ₂ CF ₃ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 29 | CH ₂ CCl ₃ | H |
| 30 | CH ₂ CCl ₃ | CH ₃ |
| 31 | CH ₂ CCl ₃ | CH ₂ CH ₃ |
| 32 | CH ₂ CCl ₃ | Cl |
| 33 | CH ₂ CCl ₃ | OCH ₃ |
| 34 | CH ₂ CCl ₃ | OC ₂ H ₅ |
| 35 | CH ₂ CCl ₃ | N(CH ₃) ₂ |
| 36 | CH ₂ CCl ₃ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 37 | CH ₂ CCl ₃ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 38 | CH ₂ CH ₂ CH ₃ | H |
| 39 | CH ₂ CH ₂ CH ₃ | CH ₃ |
| 40 | CH ₂ CH ₂ CH ₃ | CH ₂ CH ₃ |
| 41 | CH ₂ CH ₂ CH ₃ | CH ₂ CH ₂ CH ₃ |
| 42 | CH ₂ CH ₂ CH ₃ | Cl |

| Nr. | Y-R ¹ | X-R ² |
|-----|--|--|
| 43 | CH ₂ CH ₂ CH ₃ | OCH ₃ |
| 44 | CH ₂ CH ₂ CH ₃ | OC ₂ H ₅ |
| 45 | CH ₂ CH ₂ CH ₃ | N(CH ₃) ₂ |
| 46 | CH ₂ CH ₂ CH ₃ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 47 | CH ₂ CH ₂ CH ₃ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 48 | CH(CH ₃) ₂ | H |
| 49 | CH(CH ₃) ₂ | CH ₃ |
| 50 | CH(CH ₃) ₂ | CH ₂ CH ₃ |
| 51 | CH(CH ₃) ₂ | Cl |
| 52 | CH(CH ₃) ₂ | OCH ₃ |
| 53 | CH(CH ₃) ₂ | OC ₂ H ₅ |
| 54 | CH(CH ₃) ₂ | N(CH ₃) ₂ |
| 55 | CH(CH ₃) ₂ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 56 | CH(CH ₃) ₂ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 57 | (±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | H |
| 58 | (±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | CH ₃ |
| 59 | (±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | CH ₂ CH ₃ |
| 60 | (±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | Cl |
| 61 | (±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | OCH ₃ |
| 62 | (±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | OC ₂ H ₅ |
| 63 | (±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | N(CH ₃) ₂ |
| 64 | (±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 65 | (±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 66 | (S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | H |
| 67 | (S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | CH ₃ |
| 68 | (S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | CH ₂ CH ₃ |
| 69 | (S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | Cl |
| 70 | (S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | OCH ₃ |
| 71 | (S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | OC ₂ H ₅ |
| 72 | (S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | N(CH ₃) ₂ |

| Nr. | Y-R ¹ | X-R ² |
|-----|--|--|
| 73 | (S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 74 | (S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 75 | (R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | H |
| 76 | (R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | CH ₃ |
| 77 | (R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | CH ₂ CH ₃ |
| 78 | (R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | Cl |
| 79 | (R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | OCH ₃ |
| 80 | (R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | OC ₂ H ₅ |
| 81 | (R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | N(CH ₃) ₂ |
| 82 | (R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 83 | (R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 84 | (±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | H |
| 85 | (±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | CH ₃ |
| 86 | (±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | CH ₂ CH ₃ |
| 87 | (±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | Cl |
| 88 | (±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | OCH ₃ |
| 89 | (±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | OC ₂ H ₅ |
| 90 | (±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | N(CH ₃) ₂ |
| 91 | (±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 92 | (±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 93 | (S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | H |
| 94 | (S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | CH ₃ |
| 95 | (S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | CH ₂ CH ₃ |
| 96 | (S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | Cl |
| 97 | (S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | OCH ₃ |
| 98 | (S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | OC ₂ H ₅ |
| 99 | (S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | N(CH ₃) ₂ |
| 100 | (S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 101 | (S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 102 | (R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | H |

| Nr. | Y-R ¹ | X-R ² |
|-----|--|--|
| 103 | (R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | CH ₃ |
| 104 | (R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | CH ₂ CH ₃ |
| 105 | (R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | Cl |
| 106 | (R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | OCH ₃ |
| 107 | (R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | OC ₂ H ₅ |
| 108 | (R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | N(CH ₃) ₂ |
| 109 | (R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 110 | (R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 111 | (±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | H |
| 112 | (±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | CH ₃ |
| 113 | (±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | CH ₂ CH ₃ |
| 114 | (±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | Cl |
| 115 | (±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | OCH ₃ |
| 116 | (±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | OC ₂ H ₅ |
| 117 | (±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | N(CH ₃) ₂ |
| 118 | (±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 119 | (±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 120 | (S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | H |
| 121 | (S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | CH ₃ |
| 122 | (S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | CH ₂ CH ₃ |
| 123 | (S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | Cl |
| 124 | (S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | OCH ₃ |
| 125 | (S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | OC ₂ H ₅ |
| 126 | (S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | N(CH ₃) ₂ |
| 127 | (S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 128 | (S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 129 | (R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | H |
| 130 | (R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | CH ₃ |
| 131 | (R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | CH ₂ CH ₃ |
| 132 | (R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | Cl |

| Nr. | Y-R ¹ | X-R ² |
|-----|---|--|
| 133 | (R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | OCH ₃ |
| 134 | (R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | OC ₂ H ₅ |
| 135 | (R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | N(CH ₃) ₂ |
| 136 | (R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 137 | (R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 138 | (±) CH(CH ₃)-CF ₃ | H |
| 139 | (±) CH(CH ₃)-CF ₃ | CH ₃ |
| 140 | (±) CH(CH ₃)-CF ₃ | CH ₂ CH ₃ |
| 141 | (±) CH(CH ₃)-CF ₃ | Cl |
| 142 | (±) CH(CH ₃)-CF ₃ | OCH ₃ |
| 143 | (±) CH(CH ₃)-CF ₃ | OC ₂ H ₅ |
| 144 | (±) CH(CH ₃)-CF ₃ | N(CH ₃) ₂ |
| 145 | (±) CH(CH ₃)-CF ₃ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 146 | (±) CH(CH ₃)-CF ₃ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 147 | (S) CH(CH ₃)-CF ₃ | H |
| 148 | (S) CH(CH ₃)-CF ₃ | CH ₃ |
| 149 | (S) CH(CH ₃)-CF ₃ | CH ₂ CH ₃ |
| 150 | (S) CH(CH ₃)-CF ₃ | Cl |
| 151 | (S) CH(CH ₃)-CF ₃ | OCH ₃ |
| 152 | (S) CH(CH ₃)-CF ₃ | OC ₂ H ₅ |
| 153 | (S) CH(CH ₃)-CF ₃ | N(CH ₃) ₂ |
| 154 | (S) CH(CH ₃)-CF ₃ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 155 | (S) CH(CH ₃)-CF ₃ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 156 | (R) CH(CH ₃)-CF ₃ | H |
| 157 | (R) CH(CH ₃)-CF ₃ | CH ₃ |
| 158 | (R) CH(CH ₃)-CF ₃ | CH ₂ CH ₃ |
| 159 | (R) CH(CH ₃)-CF ₃ | Cl |
| 160 | (R) CH(CH ₃)-CF ₃ | OCH ₃ |
| 161 | (R) CH(CH ₃)-CF ₃ | OC ₂ H ₅ |
| 162 | (R) CH(CH ₃)-CF ₃ | N(CH ₃) ₂ |

| Nr. | Y-R ¹ | X-R ² |
|-----|---|--|
| 163 | (R) CH(CH ₃)-CF ₃ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 164 | (R) CH(CH ₃)-CF ₃ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 165 | (±) CH(CH ₃)-CCl ₃ | H |
| 166 | (±) CH(CH ₃)-CCl ₃ | CH ₃ |
| 167 | (±) CH(CH ₃)-CCl ₃ | CH ₂ CH ₃ |
| 168 | (±) CH(CH ₃)-CCl ₃ | Cl |
| 169 | (±) CH(CH ₃)-CCl ₃ | OCH ₃ |
| 170 | (±) CH(CH ₃)-CCl ₃ | OC ₂ H ₅ |
| 171 | (±) CH(CH ₃)-CCl ₃ | N(CH ₃) ₂ |
| 172 | (±) CH(CH ₃)-CCl ₃ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 173 | (±) CH(CH ₃)-CCl ₃ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 174 | (S) CH(CH ₃)-CCl ₃ | H |
| 175 | (S) CH(CH ₃)-CCl ₃ | CH ₃ |
| 176 | (S) CH(CH ₃)-CCl ₃ | CH ₂ CH ₃ |
| 177 | (S) CH(CH ₃)-CCl ₃ | Cl |
| 178 | (S) CH(CH ₃)-CCl ₃ | OCH ₃ |
| 179 | (S) CH(CH ₃)-CCl ₃ | OC ₂ H ₅ |
| 180 | (S) CH(CH ₃)-CCl ₃ | N(CH ₃) ₂ |
| 181 | (S) CH(CH ₃)-CCl ₃ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 182 | (S) CH(CH ₃)-CCl ₃ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 183 | (R) CH(CH ₃)-CCl ₃ | H |
| 184 | (R) CH(CH ₃)-CCl ₃ | CH ₃ |
| 185 | (R) CH(CH ₃)-CCl ₃ | CH ₂ CH ₃ |
| 186 | (R) CH(CH ₃)-CCl ₃ | Cl |
| 187 | (R) CH(CH ₃)-CCl ₃ | OCH ₃ |
| 188 | (R) CH(CH ₃)-CCl ₃ | OC ₂ H ₅ |
| 189 | (R) CH(CH ₃)-CCl ₃ | N(CH ₃) ₂ |
| 190 | (R) CH(CH ₃)-CCl ₃ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 191 | (R) CH(CH ₃)-CCl ₃ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 192 | CH ₂ CF ₂ CF ₃ | H |

| Nr. | Y-R ¹ | X-R ² |
|-----|---|--|
| 193 | CH ₂ CF ₂ CF ₃ | CH ₃ |
| 194 | CH ₂ CF ₂ CF ₃ | CH ₂ CH ₃ |
| 195 | CH ₂ CF ₂ CF ₃ | Cl |
| 196 | CH ₂ CF ₂ CF ₃ | OCH ₃ |
| 197 | CH ₂ CF ₂ CF ₃ | OC ₂ H ₅ |
| 198 | CH ₂ CF ₂ CF ₃ | N(CH ₃) ₂ |
| 199 | CH ₂ CF ₂ CF ₃ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 200 | CH ₂ CF ₂ CF ₃ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 201 | CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃ | H |
| 202 | CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃ | CH ₃ |
| 203 | CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃ | CH ₂ CH ₃ |
| 204 | CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃ | Cl |
| 205 | CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃ | OCH ₃ |
| 206 | CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃ | OC ₂ H ₅ |
| 207 | CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃ | N(CH ₃) ₂ |
| 208 | CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 209 | CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 210 | CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂ | H |
| 211 | CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂ | CH ₃ |
| 212 | CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂ | CH ₂ CH ₃ |
| 213 | CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂ | Cl |
| 214 | CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂ | OCH ₃ |
| 215 | CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂ | OC ₂ H ₅ |
| 216 | CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂ | N(CH ₃) ₂ |
| 217 | CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 218 | CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 219 | CH ₂ CH=CH ₂ | H |
| 220 | CH ₂ CH=CH ₂ | CH ₃ |
| 221 | CH ₂ CH=CH ₂ | CH ₂ CH ₃ |
| 222 | CH ₂ CH=CH ₂ | Cl |

| Nr. | Y-R ¹ | X-R ² |
|-----|---|--|
| 223 | CH ₂ CH=CH ₂ | OCH ₃ |
| 224 | CH ₂ CH=CH ₂ | OC ₂ H ₅ |
| 225 | CH ₂ CH=CH ₂ | N(CH ₃) ₂ |
| 226 | CH ₂ CH=CH ₂ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 227 | CH ₂ CH=CH ₂ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 228 | CH(CH ₃)CH=CH ₂ | H |
| 229 | CH(CH ₃)CH=CH ₂ | CH ₃ |
| 230 | CH(CH ₃)CH=CH ₂ | CH ₂ CH ₃ |
| 231 | CH(CH ₃)CH=CH ₂ | Cl |
| 232 | CH(CH ₃)CH=CH ₂ | OCH ₃ |
| 233 | CH(CH ₃)CH=CH ₂ | OC ₂ H ₅ |
| 234 | CH(CH ₃)CH=CH ₂ | N(CH ₃) ₂ |
| 235 | CH(CH ₃)CH=CH ₂ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 236 | CH(CH ₃)CH=CH ₂ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 237 | CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂ | H |
| 238 | CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂ | CH ₃ |
| 239 | CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂ | CH ₂ CH ₃ |
| 240 | CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂ | Cl |
| 241 | CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂ | OCH ₃ |
| 242 | CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂ | OC ₂ H ₅ |
| 243 | CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂ | N(CH ₃) ₂ |
| 244 | CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 245 | CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 246 | Cyclopentyl | H |
| 247 | Cyclopentyl | CH ₃ |
| 248 | Cyclopentyl | CH ₂ CH ₃ |
| 249 | Cyclopentyl | Cl |
| 250 | Cyclopentyl | OCH ₃ |
| 251 | Cyclopentyl | OC ₂ H ₅ |
| 252 | Cyclopentyl | N(CH ₃) ₂ |

| Nr. | Y-R ¹ | X-R ² |
|-----|---------------------------------|--|
| 253 | Cyclopentyl | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 254 | Cyclopentyl | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 255 | Cyclohexyl | H |
| 256 | Cyclohexyl | CH ₃ |
| 257 | Cyclohexyl | CH ₂ CH ₃ |
| 258 | Cyclohexyl | Cl |
| 259 | Cyclohexyl | OCH ₃ |
| 260 | Cyclohexyl | OC ₂ H ₅ |
| 261 | Cyclohexyl | N(CH ₃) ₂ |
| 262 | Cyclohexyl | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 263 | Cyclohexyl | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 264 | CF ₃ | H |
| 265 | CF ₃ | CH ₃ |
| 266 | CF ₃ | CH ₂ CH ₃ |
| 267 | CF ₃ | Cl |
| 268 | CF ₃ | OCH ₃ |
| 269 | CF ₃ | OC ₂ H ₅ |
| 270 | CF ₃ | N(CH ₃) ₂ |
| 271 | CF ₃ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 272 | CF ₃ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 273 | CCl ₃ | H |
| 274 | CCl ₃ | CH ₃ |
| 275 | CCl ₃ | CH ₂ CH ₃ |
| 276 | CCl ₃ | Cl |
| 277 | CCl ₃ | OCH ₃ |
| 278 | CCl ₃ | OC ₂ H ₅ |
| 279 | CCl ₃ | N(CH ₃) ₂ |
| 280 | CCl ₃ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 281 | CCl ₃ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 282 | CF ₂ CF ₃ | H |

| Nr. | Y-R ¹ | X-R ² |
|-----|---|--|
| 283 | CF ₂ CF ₃ | CH ₃ |
| 284 | CF ₂ CF ₃ | CH ₂ CH ₃ |
| 285 | CF ₂ CF ₃ | Cl |
| 286 | CF ₂ CF ₃ | OCH ₃ |
| 287 | CF ₂ CF ₃ | OC ₂ H ₅ |
| 288 | CF ₂ CF ₃ | N(CH ₃) ₂ |
| 289 | CF ₂ CF ₃ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 290 | CF ₂ CF ₃ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 291 | (CF ₂) ₂ CF ₃ | H |
| 292 | (CF ₂) ₂ CF ₃ | CH ₃ |
| 293 | (CF ₂) ₂ CF ₃ | CH ₂ CH ₃ |
| 294 | (CF ₂) ₂ CF ₃ | Cl |
| 295 | (CF ₂) ₂ CF ₃ | OCH ₃ |
| 296 | (CF ₂) ₂ CF ₃ | OC ₂ H ₅ |
| 297 | (CF ₂) ₂ CF ₃ | N(CH ₃) ₂ |
| 298 | (CF ₂) ₂ CF ₃ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 299 | (CF ₂) ₂ CF ₃ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 300 | C(CH ₃)=CH ₂ | H |
| 301 | C(CH ₃)=CH ₂ | CH ₃ |
| 302 | C(CH ₃)=CH ₂ | CH ₂ CH ₃ |
| 303 | C(CH ₃)=CH ₂ | Cl |
| 304 | C(CH ₃)=CH ₂ | OCH ₃ |
| 305 | C(CH ₃)=CH ₂ | OC ₂ H ₅ |
| 306 | C(CH ₃)=CH ₂ | N(CH ₃) ₂ |
| 307 | C(CH ₃)=CH ₂ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 308 | C(CH ₃)=CH ₂ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 309 | CH=CH ₂ | H |
| 310 | CH=CH ₂ | CH ₃ |
| 311 | CH=CH ₂ | CH ₂ CH ₃ |
| 312 | CH=CH ₂ | Cl |

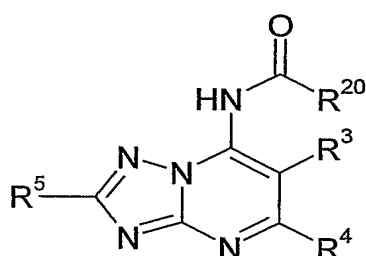
| Nr. | Y-R ¹ | X-R ² |
|-----|--|--|
| 313 | CH=CH ₂ | OCH ₃ |
| 314 | CH=CH ₂ | OC ₂ H ₅ |
| 315 | CH=CH ₂ | N(CH ₃) ₂ |
| 316 | CH=CH ₂ | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 317 | CH=CH ₂ | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 318 | Phenyl | H |
| 319 | Phenyl | CH ₃ |
| 320 | Phenyl | CH ₂ CH ₃ |
| 321 | Phenyl | Cl |
| 322 | Phenyl | OCH ₃ |
| 323 | Phenyl | OC ₂ H ₅ |
| 324 | Phenyl | N(CH ₃) ₂ |
| 325 | Phenyl | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 326 | Phenyl | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 327 | CH ₂ Phenyl | H |
| 328 | CH ₂ Phenyl | CH ₃ |
| 329 | CH ₂ Phenyl | CH ₂ CH ₃ |
| 330 | CH ₂ Phenyl | Cl |
| 331 | CH ₂ Phenyl | OCH ₃ |
| 332 | CH ₂ Phenyl | OC ₂ H ₅ |
| 333 | CH ₂ Phenyl | N(CH ₃) ₂ |
| 334 | CH ₂ Phenyl | N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 335 | CH ₂ Phenyl | N(CH ₃)C(O)CH ₃ |
| 336 | -(CH ₂) ₂ CH=CHCH ₂ - | |
| 337 | -(CH ₂) ₂ C(CH ₃)=CHCH ₂ - | |
| 338 | -(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ - | |
| 339 | -(CH ₂) ₂ CHF(CH ₂) ₂ - | |
| 340 | -(CH ₂) ₃ CHFCH ₂ - | |
| 341 | -(CH ₂) ₂ CH(CF ₃)(CH ₂) ₂ - | |
| 342 | -(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ - | |

53

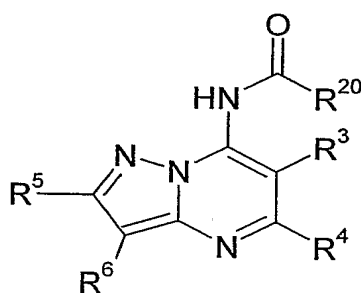
| Nr. | Y-R ¹ | X-R ² |
|-----|--|------------------|
| 343 | -(CH ₂) ₂ S(CH ₂) ₂ - | |
| 344 | -(CH ₂) ₅ - | |
| 345 | -(CH ₂) ₆ - | |
| 346 | -(CH ₂) ₄ - | |
| 347 | -CH ₂ CH=CHCH ₂ - | |
| 348 | -CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ - | |
| 349 | -CH ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ - | |

Weitere bevorzugte Ausführungsformen der Erfindung betreffen Tautomere der Formel II. Unter den Tautomeren der allgemeinen Formel II sind solche Verbindungen bevorzugt, worin W^a für O oder S steht. In den Tautomeren der Formel II steht V vorzugsweise für eine chemische Bindung. Bezüglich bevorzugter Bedeutungen der Variablen R³, R⁴, R⁵ und A gilt das zuvor für Formel I gesagte. Bevorzugte Reste R²⁰ sind solche, die in Formel I als bevorzugte Reste für R¹ bzw. R² angegeben werden. Insbesondere steht R²⁰ für einen Rest der Formeln A oder B wie für R¹ bzw. R² angegeben.

10 Bevorzugte Tautomere II sind insbesondere die Verbindungen der Formeln II-A und II-B



(II-A)



(II-B)

15 worin R³, R⁴, R⁵, R⁶ und R²⁰ die zuvor angegebenen Bedeutungen aufweisen.

Hierunter besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R³ für 2-Fluor-6-chlorphenyl steht, R⁴ für Chlor steht, R⁵ Wasserstoff bedeutet, R⁶ Wasserstoff bedeutet und R²⁰ die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A1 und II-B1). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A1.1 bis II-A1.39 und II-B1.1 bis II-B1.39, worin R²⁰ die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

54

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,6-Difluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die auch zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A2 und II-B2). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A2.1 bis II-A2.39 und II-B2.1 bis II-B2.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind weiterhin die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,6-Dichlorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A3 und II-B3). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A3.1 bis II-A3.39 und II-B3.1 bis II-B3.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Fluor-6-methylphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A4 und II-B4). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A4.1 bis II-A4.39 und II-B4.1 bis II-B4.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,4,6-Trifluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A5 und II-B5). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A5.1 bis II-A5.39 und II-B5.1 bis II-B5.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,6-Difluor-4-methoxyphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A6 und II-B6). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A6.1 bis II-A6.39 und II-B6.1 bis II-B6.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Fluor-6-chlorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A7 und II-B7). Beispiele

hierfür sind die Verbindungen II-A7.1 bis II-A7.39 und II-B7.1 bis II-B7.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

5 Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für Pentafluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A8 und II-B8). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A8.1 bis II-A8.39 und II-B8.1 bis II-B8.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

10

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Methyl-4-fluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A4 und II-B4). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A9.1 bis II-A9.39 und II-B9.1 bis II-B9.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

15

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Trifluormethylphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A10 und II-B10). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A10.1 bis II-A10.39 und II-B10.1 bis II-B10.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

20

25 Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Methoxy-6-fluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A11 und II-B11). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A11.1 bis II-A11.39 und II-B11.1 bis II-B11.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

30

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Chlorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A12 und II-B12). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A12.1 bis II-A12.39 und II-B12.1 bis II-B12.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

35

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Fluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A13 und II-B13). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A13.1 bis II-A13.39 und II-B13.1 bis II-B13.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,4-Difluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A14 und II-B14). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A14.1 bis II-A14.39 und II-B14.1 bis II-B14.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Fluor-4-chlorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A15 und II-B15). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A15.1 bis II-A15.39 und II-B15.1 bis II-B15.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 4-Fluor-2-chlorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A16 und II-B16). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A16.1 bis II-A16.39 und II-B16.1 bis II-B16.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,3-Difluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A17 und II-B17). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A17.1 bis II-A17.39 und II-B17.1 bis II-B17.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,5-Difluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A18 und II-B18). Beispiele

hierfür sind die Verbindungen II-A18.1 bis II-A18.39 und II-B18.1 bis II-B18.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

5 Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,3,4-Trifluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A19 und II-B19). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A19.1 bis II-A19.39 und II-B19.1 bis II-B19.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

10

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Methylphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A20 und II-B20). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A20.1 bis II-A20.39 und II-B20.1 bis II-B20.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

15

20 Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,4-Dimethylphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A21 und II-B21). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A21.1 bis II-A21.39 und II-B21.1 bis II-B21.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

25

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Methyl-4-chlorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A22 und II-B22). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A22.1 bis II-A22.39 und II-B22.1 bis II-B22.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

30

35 Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Fluor-4-methylphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A23 und II-B23). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A23.1 bis II-A23.39 und II-B23.1 bis II-B23.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,6-Dimethylphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A24 und II-B24). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A24.1 bis II-A24.39 und II-B24.1 bis II-B24.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,4,5-Trimethylphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A25 und II-B25). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A25.1 bis II-A25.39 und II-B25.1 bis II-B25.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,6-Difluor-4-cyanophenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A26 und II-B26). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A26.1 bis II-A26.39 und II-B26.1 bis II-B26.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,6-Difluor-4-methylphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A27 und II-B27). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A27.1 bis II-A27.39 und II-B27.1 bis II-B27.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,6-Difluor-4-methoxycarbonylphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A28 und II-B28). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A28.1 bis II-A28.39 und II-B28.1 bis II-B28.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Trifluormethyl-4-fluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-29 und II-B29).

Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A29.1 bis II-A29.39 und II-B29.1 bis II-B29.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

5 Hierunter besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Trifluormethyl-5-fluorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A30 und II-B30). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A30.1 bis II-A30.39 und II-B30.1 bis II-B30.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

10

Hierunter besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Trifluormethyl-5-chlorphenyl steht, R^4 für Chlor steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A31 und II-B31). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A31.1 bis II-A31.39 und II-B31.1 bis II-B31.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

15

20 Hierunter besonders bevorzugt sind weiterhin die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Fluor-6-chlorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A32 und II-B32). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A32.1 bis II-A32.39 und II-B32.1 bis II-B32.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

25

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,6-Difluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die auch zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A33 und II-B33). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A33.1 bis II-A33.39 und II-B33.1 bis II-B33.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

30

35 Hierunter besonders bevorzugt sind weiterhin die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,6-Dichlorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A34 und II-B34). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A34.1 bis II-A34.39 und II-B34.1 bis II-B34.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

35

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Fluor-6-methylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A35 und II-B35). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A35.1 bis II-A35.39 und II-B35.1 bis II-B35.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,4,6-Trifluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A36 und II-B36). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A36.1 bis II-A36.39 und II-B36.1 bis II-B36.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,6-Difluor-4-methoxyphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A37 und II-B37). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A37.1 bis II-A37.39 und II-B37.1 bis II-B37.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Fluor-6-chlorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A38 und II-B38). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A38.1 bis II-A38.39 und II-B38.1 bis II-B38.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Methyl-4-fluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A39 und II-B39). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A39.1 bis II-A39.39 und II-B39.1 bis II-B39.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für Pentafluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A40 und II-B40). Beispiele

hierfür sind die Verbindungen II-A40.1 bis II-A40.39 und II-B40.1 bis II-B40.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

5 Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Trifluormethylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A41 und II-B41). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A41.1 bis II-A41.39 und II-B41.1 bis II-B41.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

10

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Methoxy-6-fluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A42 und II-B42). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A42.1 bis II-A42.39 und II-B42.1 bis II-B42.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

15

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Chlorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A43 und II-B43). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A43.1 bis II-A43.39 und II-B43.1 bis II-B43.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

20

25 Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Fluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A44 und II-B44). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A44.1 bis II-A44.39 und II-B44.1 bis II-B44.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

30

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,4-Difluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A45 und II-B45). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A45.1 bis II-A45.39 und II-B45.1 bis II-B45.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

35

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Fluor-4-chlorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-46 und II-B46). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A46.1 bis II-A46.39 und II-B46.1 bis II-B46.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 4-Fluor-2-chlorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A47 und II-B47). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A47.1 bis II-A47.39 und II-B47.1 bis II-B47.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,3-Difluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A48 und II-B48). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A48.1 bis II-A48.39 und II-B48.1 bis II-B48.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,5-Difluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A49 und II-B49). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A49.1 bis II-A49.39 und II-B49.1 bis II-B49.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,3,4-Trifluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A50 und II-B50). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A50.1 bis II-A50.39 und II-B50.1 bis II-B50.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Methylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A51 und II-B51). Beispiele

hierfür sind die Verbindungen II-A51.1 bis II-A51.39 und II-B51.1 bis II-B51.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

5 Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,4-Dimethylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A52 und II-B52). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A52.1 bis II-A52.39 und II-B52.1 bis II-B52.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

10

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Methyl-4-chlorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A53 und II-B53). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A53.1 bis II-A53.39 und II-B53.1 bis II-B53.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

15

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Fluor-4-methylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A54 und II-B54). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A54.1 bis II-A54.39 und II-B54.1 bis II-B54.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

20

25 Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,6-Dimethylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A55 und II-B55). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A55.1 bis II-A55.39 und II-B55.1 bis II-B55.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

30

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,4,5-Trimethylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A56 und II-B56). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A56.1 bis II-A56.39 und II-B56.1 bis II-B56.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

35

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,6-Difluor-4-cyanophenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A57 und II-B57).

- 5 Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A57.1 bis II-A57.39 und II-B57.1 bis II-B57.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,6-Difluor-4-methylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A58 und II-B58). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A58.1 bis II-A58.39 und II-B58.1 bis II-B58.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

- 10 Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2,6-Difluor-4-methoxycarbonylphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A59 und II-B59). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A59.1 bis II-A59.39 und II-B59.1 bis II-B59.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

- 20 Hierunter besonders bevorzugt sind auch die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Trifluormethyl-4-fluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-60 und II-B60). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A60.1 bis II-A60.39 und II-B60.1 bis II-B60.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

- 30 Hierunter besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Trifluormethyl-5-fluorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A61 und II-B61). Beispiele hierfür sind die Verbindungen II-A61.1 bis II-A61.39 und II-B61.1 bis II-B61.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

- 40 Hierunter besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formeln II-A und II-B, worin R^3 für 2-Trifluormethyl-5-chlorphenyl steht, R^4 für Methyl steht, R^5 Wasserstoff bedeutet, R^6 Wasserstoff bedeutet und R^{20} die zuvor genannten und insbesondere die als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweisen (Verbindungen II-A62 und II-B62). Bei-
M/45025

spiele hierfür sind die Verbindungen II-A62.1 bis II-A62.39 und II-B62.1 bis II-B62.39, worin R^{20} die in einer Zeile der Tabelle B angegebene Bedeutung aufweist.

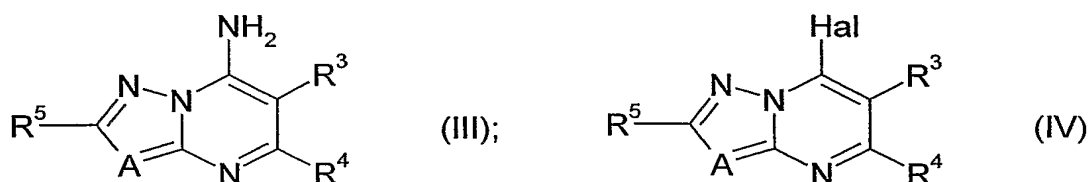
Tabelle B

| Nr. | R^{20} |
|-----|---|
| 1 | H |
| 2 | CH_3 |
| 3 | CH_2CH_3 |
| 4 | CH_2CF_3 |
| 5 | CH_2CCl_3 |
| 6 | $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ |
| 7 | $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ |
| 8 | $(\pm) \text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{CH}_3$ |
| 9 | $(S) \text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{CH}_3$ |
| 0 | $(R) \text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{CH}_3$ |
| 11 | $(\pm) \text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$ |
| 12 | $(S) \text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$ |
| 13 | $(R) \text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$ |
| 14 | $(\pm) \text{CH}(\text{CH}_3)\text{-C}(\text{CH}_3)_3$ |
| 15 | $(S) \text{CH}(\text{CH}_3)\text{-C}(\text{CH}_3)_3$ |
| 16 | $(R) \text{CH}(\text{CH}_3)\text{-C}(\text{CH}_3)_3$ |
| 17 | $(\pm) \text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CF}_3$ |
| 18 | $(S) \text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CF}_3$ |
| 19 | $(R) \text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CF}_3$ |
| 20 | $(\pm) \text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CCl}_3$ |
| 21 | $(S) \text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CCl}_3$ |
| 22 | $(R) \text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CCl}_3$ |
| 23 | $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ |
| 24 | $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_2\text{CF}_3$ |
| 25 | $\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$ |
| 26 | $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ |
| 27 | $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CH}_2$ |

| Nr. | R ²⁰ |
|-----|---|
| 28 | CH(CH ₃)C(CH ₃)=CH ₂ |
| 29 | Cyclopentyl |
| 30 | Cyclohexyl |
| 31 | Cyclopropyl |
| 32 | CF ₃ |
| 33 | CCl ₃ |
| 34 | CF ₂ CF ₃ |
| 35 | (CF ₂) ₂ CF ₃ |
| 36 | C(CH ₃)=CH ₂ |
| 37 | CH=CH ₂ |
| 38 | Phenyl |
| 39 | CH ₂ Phenyl |

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I können in Analogie zu an sich bekannten Methoden des Standes der Technik ausgehend von 7-Aminoazolo-
pyrimidinen der allgemeinen Formel III oder 7-Halogenazolopyrimidinen der Formel IV

5



10

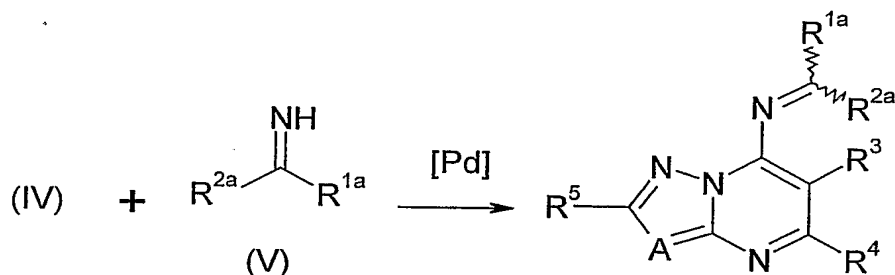
nach den in den folgenden Schemata dargestellten Synthesen hergestellt werden. In den Verbindungen der Formeln III und IV haben A, R³, R⁴ und R⁵ die vorgenannten Bedeutungen. Hal steht für Halogen, insbesondere für Chlor oder Brom. Die Verbindungen III und IV sind aus dem eingangs zitierten Stand der Technik bekannt oder können in Analogie zu den dort beschriebenen Verfahren hergestellt werden.

15

Verbindungen der Formel I, worin X und Y für eine chemische Bindung stehen, können beispielsweise nach dem von G. A. Grasa et al. J. Org. Chem. 2001, 66(23) S.7729-7737 oder Stauffer et. al, Org. Lett. 2002, 2(10), S.1423-1426 beschriebenen Methoden durch Umsetzung des 7-Haloazolopyrimidins IV mit einem Imin der Formel V in Gegenwart von Palladium-Katalysatoren hergestellt werden (siehe Schema 1)

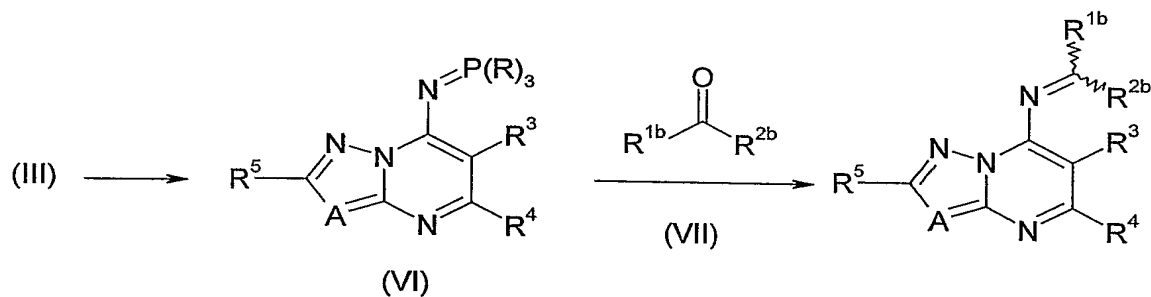
20

Schema 1:
M/45025



In Schema 1 haben A, R³, R⁴ und R⁵ die zuvor genannten Bedeutungen. R^{1a} und R^{2a} stehen unabhängig voneinander für Wasserstoff oder haben die für R¹ bzw. R² angegebenen Bedeutungen oder R^{1a} bildet mit R^{2a} und mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-, 6 oder 7-gliedrigen, gesättigten oder ungesättigten Carbo- oder Heterocyclus, wobei letzterer 1, 2, 3 oder 4 Heteroatome, ausgewählt unter O, S und N als Ringglied aufweisen kann, wobei der Carbo- und der Heterocyclus teilweise oder vollständig halogeniert sein können oder 1, 2, 3 oder 4 der Reste R⁷ und/oder R⁸ aufweisen können.

Verbindungen der Formel I, worin X und Y für eine chemische Bindung stehen, können weiterhin nach dem in Schema 2 dargestellten Verfahren aus den entsprechenden 7-Aminoazolopyrimidinen III hergestellt werden. Hierzu überführt man zunächst Verbindung III nach der von Llamas-Saiz et al. beschriebenen Methode (J. Chem. Soc. Perkin Trans. 2, 1991, S.1667-1676) in das Phosphaimin VI, welches anschließend durch Umsetzung mit einem Aldehyd oder einem Keton VII nach den von Bravo et al. Synlett 1996, S. 887 ff. und Takahashi et al, Synthesis, 1998, S. 986-990 beschriebenen Methoden in die entsprechende Verbindung I umgewandelt werden kann (siehe Schema 2):

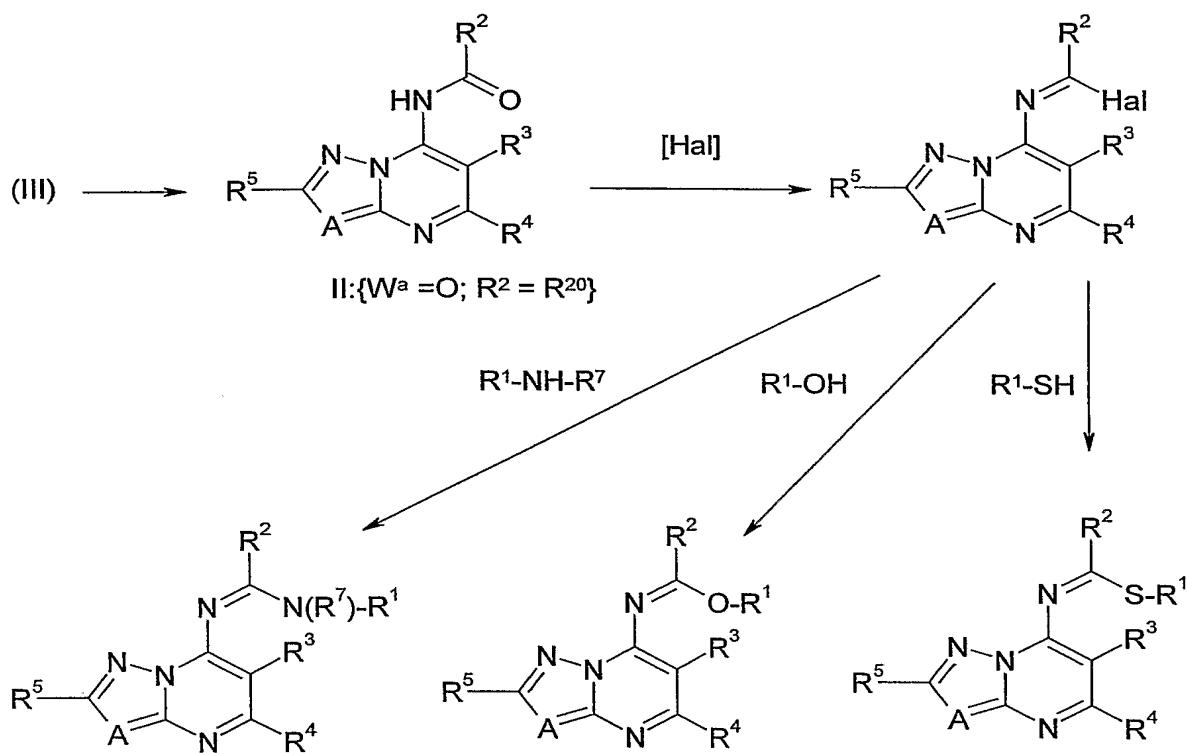


In Schema 2 haben A, R³, R⁴ und R⁵ die zuvor genannten Bedeutungen. R^{1b} und R^{2b} stehen unabhängig voneinander für Wasserstoff oder haben die für R¹ bzw. R² angegebenen Bedeutungen oder R^{1b} bildet mit R^{2b} und mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-, 6 oder 7-gliedrigen, gesättigten oder ungesättigten Carbo- oder Heterocyclus, wobei letzterer 1, 2, 3 oder 4 Heteroatome, ausgewählt unter O,

S und N als Ringglied aufweisen kann, wobei der Carbo- und der Heterocyclus teilweise oder vollständig halogeniert sein können oder 1, 2, 3 oder 4 der Reste R^7 und/oder R^8 aufweisen können. R steht für Aryl wie Phenyl, das gegebenenfalls substituiert ist, z.B. mit 1, 2 oder 3 Substituenten, die unter Halogen, Alkyl oder Alkoxy ausgewählt sind.

Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin $Y-R^1$ (oder $X-R^2$) für Halogen, X (bzw. Y) eine Einfachbindung bedeutet und R^2 die zuvor genannten Bedeutungen aufweist, können aus den entsprechenden Tautomeren der Formel II, worin W^a für Sauerstoff steht, R^{20} dem Rest R^2 entspricht und V eine Bindung bedeutet, nach der von Stevens et al., J. Am. Chem. Soc. 1953, 75, S. 657-660 beschriebenen Methode durch Umsetzung mit einem Halogenierungsmittel [Hal] hergestellt werden (siehe Schema 3).

Schema 3:

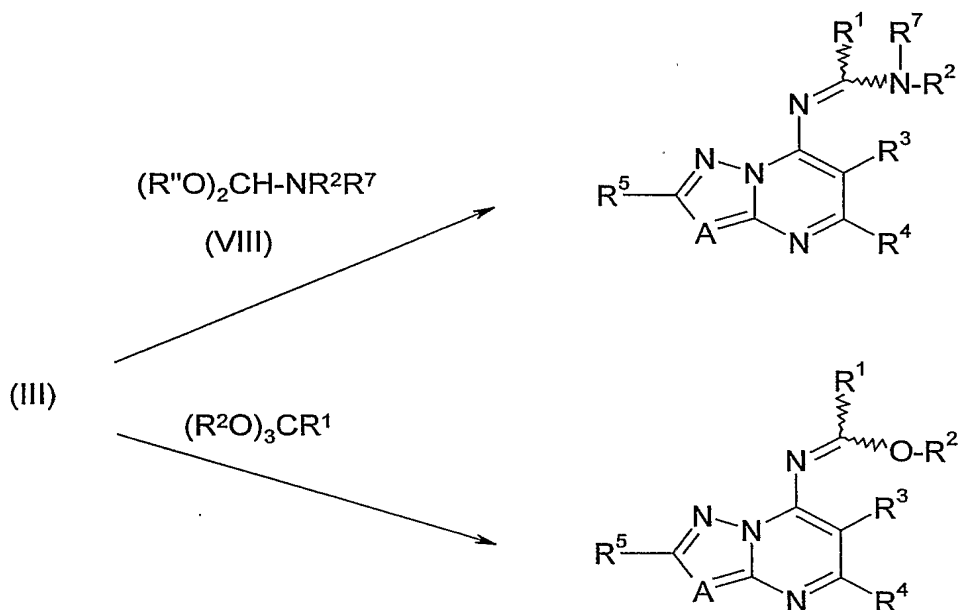


Beispiele für Halogenierungsmittel [Hal] sind Phosphorhalogenide und Schwefelhalogenverbindungen wie Phosphoroxybromid, Phosphoroxychlorid, Phosphorpentachlorid, Thionylchlorid, Thionylbromid oder Sulfurylchlorid. Die Umsetzung kann in Substanz oder in Gegenwart eines Lösungsmittels durchgeführt werden. Vorzugsweise führt man die Umsetzung in Gegenwart eines tertiären Amins wie Triethylamin oder Pyridin als Base durch. Übliche Reaktionstemperaturen betragen von -20 bis 150°C oder vorzugsweise von 0 bis 100°C .

Die Halogenverbindungen I, worin $Y-R^1$ (oder $X-R^2$) für Halogen steht, können ihrerseits in die entsprechenden Verbindungen I, worin Y für Sauerstoff steht, umgewandelt werden, indem man sie mit einem Alkohol der Formel R^1-OH nach der von Stevens et al., J. Am. Chem. Soc. 1953, 75, S. 657-660 et al. beschriebenen Methode umsetzt. In analoger Weise erhält man aus den Verbindungen I, worin $X-R^2$ für Halogen steht, die Verbindungen I, worin X für Sauerstoff steht. Außerdem kann man in analoger Weise durch Umsetzung mit sekundären Aminen der Formel R^1-NH-R^7 die Verbindungen der Formel I herstellen, worin X eine Bindung bedeutet und Y für eine Gruppe R^7 steht. Außerdem kann man in analoger Weise durch Umsetzung mit Thioalkoholen der Formel R^1-SH die Verbindungen der Formel I herstellen, worin X eine Bindung bedeutet und Y für S steht (siehe Schema 3).

Verbindungen der Formel I, worin Y für eine chemische Bindung und $X-R^2$ für einen Rest der Formel $N(R^7)R^2$ steht, kann man aus den Verbindungen III durch Umsetzung mit Carbonsäureamid-Analoga VIII nach den von S. Leistner et al., Pharmazie 1991, 46, S. 457-458, und Troschütz et al., Arch. Pharm. 1993, 326, 857-864, beschriebenen Methoden herstellen (siehe Schema 4). Verbindungen der Formel I, worin Y für eine chemische Bindung und X für O steht, kann man durch Umsetzung von III mit Orthoestern der Formel IX nach der von Troschütz et al. Arch. Pharm. 1993, 326, 857-864, beschriebenen Methode herstellen (siehe Schema 4).

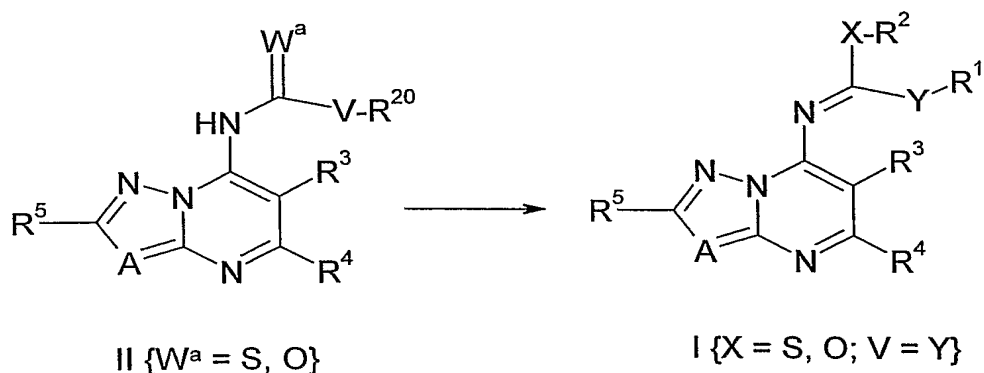
Schema 4:



Die Tautomere der Formel II, worin $W^a = O$ und V eine chemische Bindung ist, können aus den 7-Aminoazolopyrimidinen III nach üblichen Amidierungsverfahren hergestellt werden, z.B. durch Umsetzung mit Carbonsäuren oder Carbonsäurederivaten der Formel $R^{23}-CO-L$, worin R^{23} eine der für R^{20} angegebenen Bedeutungen aufweist und L für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, z.B. für OH, Halogen, insbesondere Chlor oder für den Rest einer Aktivester-Gruppe wie p-Nitrophenoxy steht, gegebenenfalls in Gegenwart geeigneter Katalysatoren, Hilfsbasen, z.B. tertiäre Amine wie Triethylamin oder Pyridin-Verbindungen, und/oder Dehydratisierungsmitteln, z.B. Carbodiimide. Methoden hierzu sind aus dem Stand der Technik bekannt und können in analoger Weise zur Herstellung der Verbindungen II mit $W^a = O$ angewendet werden (siehe z.B. Werbel et al. J. Heterocycl Chem. 1987, 24, S. 345 ; Stevens et al. loc.cit. siehe auch J. March, „Advanced Organic Synthesis, 3. Auflage, Wiley & Sons, New-York 1985, S. 370-376 und dort zitierte Literatur). Die Herstellung von Verbindungen II mit $W^a = S$ können aus den Verbindungen II mit $W^a = O$ durch Umsetzung mit Schwefelungsmitteln hergestellt werden. In analoger Weise können Verbindungen der Formel II, worin V für O oder S steht, durch Umsetzung von III mit Derivaten der Kohlensäure oder der Thiokohlensäure, z.B. Chlorameisensäureestern oder Carbonaten hergestellt werden. Verbindungen II, worin V für NH steht, können durch Umsetzung von III mit Isocyanaten oder Isothiocyanaten hergestellt werden.

Verbindungen der Formel II, worin W^a für S oder O steht, können auch durch Alkylierungsmittel in die entsprechenden Verbindungen I überführt werden, worin X für O oder S steht (Schema 5). In Schema 5 haben A , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 und R^{20} die vorgenannten Bedeutungen W^a und X stehen für S oder O. Y hat die zuvor erwähnten Bedeutungen und steht insbesondere für eine chemische Bindung.

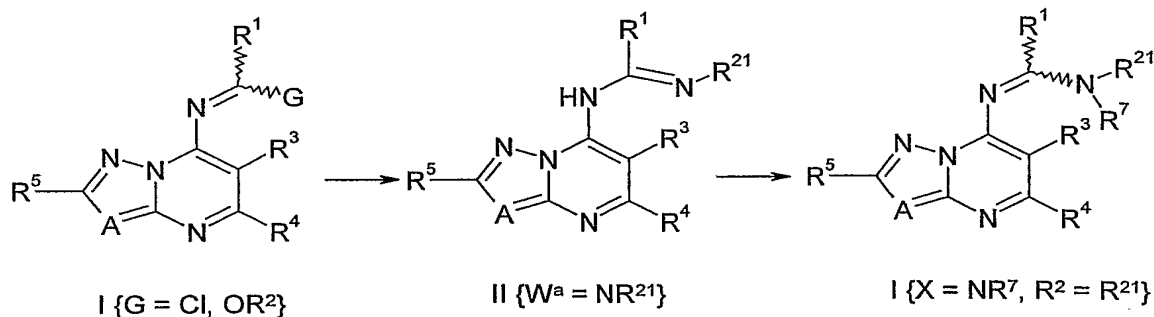
Schema 5:



Weiterhin können Verbindungen der nachstehend angegebenen Formel I, worin Y für eine chemische Bindung und X für Sauerstoff steht, sowie Verbindungen I, worin $X-R^2$ für Halogen und Y für eine chemische Bindung steht, durch Umsetzung mit Am-

71

- moniak oder einem primären Amin $\text{H}_2\text{N}-\text{R}^{21}$ in Verbindungen II umgewandelt werden, worin W^a für eine Gruppe NH oder NR^{21} steht und $\text{Y}-\text{R}^{20}$ der Gruppe R^1 entspricht (Schema 6). Diese Verbindungen können dann durch Alkylierung mit einem Alkylierungsmittel R^7-L , worin L für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht, z.B. für Halogen, (Halo)Alkylsulfonat wie Mesylat oder Triflat, oder Arylsulfonat wie Tosylat, in die Imide I überführt werden, worin Y eine chemische Bindung und X eine Gruppe NR^7 bedeuten und R^{21} dem Rest R^1 entspricht.



10

- Die in den Schemata 1 bis 6 dargestellten Reaktionen können in Substanz oder in Lösung durchgeführt werden. Geeignete Lösungsmittel sind Wasser, aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylketon, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt wird die Reaktion in Salzsäure oder Essigsäure durchgeführt. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

20

- Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet, z.B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen- und Endprodukte fallen z.T. in Form farbloser oder schwach bräunlicher, zäher Öle an, die unter vermindertem Druck und bei mäßig erhöhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gereinigt werden. Sofern die Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren oder Digerieren erfolgen.

30

Sofern einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend beschriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I hergestellt werden.

Sofern bei der Synthese Isomerengemische anfallen, ist im allgemeinen jedoch eine Trennung nicht unbedingt erforderlich, da sich die einzelnen Isomere teilweise während der Aufbereitung für die Anwendung oder bei der Anwendung (z.B. unter Licht, Säure- oder Baseneinwirkung) ineinander umwandeln können. Entsprechende Umwandlungen können auch nach der Anwendung, beispielsweise bei der Behandlung von Pflanzen in der behandelten Pflanze oder im zu bekämpfenden Schadpilz erfolgen.

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich aus durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der *Ascomyceten*, *Deuteromyceten*, *Oomyceten* und *Basidiomyceten*. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

20

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- *Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst,
- *Bipolaris*- und *Drechslera*-Arten an Getreide, Reis und Rasen,
- *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
- 25 • *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
- *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,
- *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- *Mycosphaerella*-Arten an Getreide, Bananen und Erdnüssen,
- *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
- 30 • *Plasmopara viticola* an Reben,
- *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
- *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
- *Puccinia*-Arten an Getreide,
- 35 • *Pyricularia oryzae* an Reis,
- *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- *Septoria tritici* und *Stagonospora nodorum* an Weizen,
- *Uncinula necator* an Reben,
- *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie

73

- *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Pae-*
cilomyces variotii im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich,
5 Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu
schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid
wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch
10 nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise
zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

15 Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des
gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis
0,1 g, vorzugsweise 0,01 bis 0,05 g je Kilogramm Saatgut benötigt.
20

Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an
Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts. Übliche
Aufwandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise
0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.
25

Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lö-
sungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die An-
wendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem
Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung ge-
währleisten.
30

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken
des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter
Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln. Als Lösungsmittel / Hilfsstoffe
35 kommen dafür im wesentlichen in Betracht:

- Wasser, aromatische Lösungsmittel (z.B. Solvesso Produkte, Xylol), Paraffine
(z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol, Pentanol, Benzylalko-
hol), Ketone (z.B. Cyclohexanon, gamma-Butyrolacton), Pyrrolidone (NMP,
NOP), Acetate (Glykoldiacetat), Glykole, Dimethylfettsäureamide, Fettsäuren

und Fettsäureester. Grundsätzlich können auch Lösungsmittelgemische verwendet werden,

- Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate, Fettsäuren und sulfatierte Fettalkoholglykolether zum Einsatz, ferner Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Tristerylphenylpolyglykolether, Alkyl-arylpolyetheralkohole, Alkohol- und Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfractionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Beispiele für Formulierungen umfassen Produkte zur Verdünnung in Wasser, z.B.

- 10 A Wasserlösliche Konzentrate (SL):
10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Wasser oder einem wasserlöslichen Lösungsmittel gelöst. Alternativ werden Netzmittel oder andere Hilfsmittel zugefügt. Bei der Verdünnung in Wasser löst sich der Wirkstoff;
- 15 B Dispergierbare Konzentrate (DC):
20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Cyclohexanon unter Zusatz eines Dispergiermittels z.B. Polyvinylpyrrolidon gelöst. Bei Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Dispersion;
- 20 C Emulgierbare Konzentrate (EC):
15 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion;
- 25 D Emulsionen (EW, EO):
40 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Diese Mischung wird mittels einer Emulgiermaschine (Ultraturax) in Wasser eingebracht und zu einer homogenen Emulsion gebracht. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion,
- 30
- 35 E Suspensionen (SC, OD):
20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln und Wasser oder einem organischen Lösungsmittel in einer Rührwerkskugelmühle zu einer feinen Wirkstoffsuspension zerkleinert. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Suspension des Wirkstoffs;
- 40 F Wasserdispergierbare und wasserlösliche Granulate (WG, SG):
50 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von

Dispergier- und Netzmitteln fein gemahlen und mittels technischer Geräte (z.B. Extrusion, Sprühturm, Wirbelschicht) als wasserdispergierbare oder wasserlösliche Granulate hergestellt. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs;

5

- G Wasserdispergierbare und wasserlösliche Pulver (WP, SP):
75 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln sowie Kieselsäuregel in einer Rotor-Strator Mühle vermahlen. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs;

10

sowie Produkte für die Direktapplikation, z.B.

- H Stäube (DP):
5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95 % feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält dadurch ein Stäubemittel;

15

- I Granulate (GR, FG, GG, MG):
0.5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95.5 % Trägerstoffe verbunden. Gängige Verfahren sind dabei die Extrusion, die Sprühtrocknung oder die Wirbelschicht. Man erhält dadurch ein Granulat für die Direktapplikation;

20

- J ULV- Lösungen (UL):
10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einem organischen Lösungsmittel z.B. Xylol gelöst. Dadurch erhält man ein Produkt für die Direktapplikation.

25

- 30 Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

35

- 40 Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Sub-

stanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Netzmittel, Adjuvants, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

- Acylalanine wie Benalaxyl, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl,
- Aminderivate wie Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin, Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph
- Anilinopyrimidine wie Pyrimethanil, Mepanipyrim oder Cyrodinyl,
- Antibiotika wie Cycloheximid, Griseofulvin, Kasugamycin, Natamycin, Polyoxin oder Streptomycin,
- Azole wie Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenoconazole, Dinitroconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Hexaconazol, Imazalil,

- Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol, Prochloraz, Prothioconazol, Tebuconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol,
- Dicarboximide wie Iprodion, Myclozolin, Procymidon, Vinclozolin,
 - Dithiocarbamate wie Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propineb, Polycarbat, Thiram, Ziram, Zineb,
 - Heterocyclische Verbindungen wie Anilazin, Benomyl, Boscalid, Carbendazim, Carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Dithianon, Famoxadon, Fenamidon, Fenarimol, Fuberidazol, Flutolanil, Furametpyr, Isoprothiolan, Mepronil, Nuarimol, Probenazol, Proquinazid, Pyrifenox, Pyroquilon, Quinoxifen, Silthiofam, Thiabendazol, Thifluzamid, Thiophanat-methyl, Tiadinil, Tricyclazol, Triforine,
 - Kupferfungizide wie Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferoxychlorid, basisches Kupfersulfat,
 - Nitrophenylderivate, wie Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, Nitrophthal-isopropyl
 - Phenylpyrrole wie Fenpiclonil oder Fludioxonil,
 - Schwefel
 - Sonstige Fungizide wie Acibenzolar-S-methyl, Benthiavalicarb, Carpropamid, Chlorothalonil, Cyflufenamid, Cymoxanil, Dazomet, Diclomezin, Diclocymet, Diethofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-Acetat, Fenoxanil, Ferimzone, Fluazinam, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Iprovalicarb, Hexachlorbenzol, Metrafenon, Pencycuron, Propamocarb, Phthalid, Toloclofos-methyl, Quintozene, Zoxamid
 - Strobilurine wie Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-methyl, Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin,
 - Sulfensäurederivate wie Captafol, Captan, Dichlofluanid, Folpet, Tolyfluanid
 - Zimtsäureamide und Analoge wie Dimethomorph, Flumetover oder Flumorph.

Synthesebeispiele

- Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in den anschließenden Tabellen mit physikalischen Angaben aufgeführt.

Beispiel 1: N'-[5-Chlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-(1,2,4-triazolo-[1,5-a]pyrimidin-7-yl)]-N,N-dimethylformamidin

- In einem Kolben legte man 3 ml Dimethylformamid vor, kühlte auf -8°C , tropfte hierzu 0,5 ml Phosphorylchlorid (POCl_3) und rührte 5 min. bei -8°C . Anschließend gab man hierzu eine Lösung von 336 mg 7-Amino-5-chlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)triazolo[1,5-a]pyrimidin-Hydrochlorid in 1 ml Dimethylformamid und 0,14 ml Triethylamin. Nach 1 h entfernte man die Kühlung und rührte 72 h nach. Dann gab man die Reaktionsmi-
- M/45025

schung auf Eiswasser, stellte mit konzentriertem Ammoniak alkalisch und saugte den entstandenen Niederschlag ab. Man erhielt so die Titelverbindung in einer Ausbeute von 66 % mit einem Schmelzpunkt von 188-190°C.

- 5 Beispiel 2: N-[5-Chlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-(1,2,4-triazolo-[1,5-a]pyrimidin-7-yl)]-acetamid

18 ml Toluol, 0,3 ml Triethylamin, 88 mg Acetylchlorid und 250 mg 7-Amino-5-chlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)triazolo[1,5-a]pyrimidin-Hydrochlorid wurden 12 h bei 120°C
10 gerührt. Man kühlte auf Raumtemperatur und engte im Vakuum ein, wobei man einen beigefarbenen Rückstand erhielt. Dieser wurde in Dichlormethan aufgenommen und die Mischung mit Wasser gewaschen. Die organische Phase wurde im Vakuum eingengt wobei man die Titelverbindung in einer Ausbeute von 31 % als beigefarbenen Feststoff mit einem Schmelzpunkt von 227-230°C erhielt.

15 Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der Formel I ließ sich durch die folgenden Versuche zeigen:

20 Die Wirkstoffe wurden getrennt als eine Stammlösung aufbereitet mit 0,25 Gew.-% Wirkstoff in Aceton oder DMSO. Dieser Lösung wurde 1 Gew.-% Emulgator Uniperol® EL (Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) zugesetzt und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser
25 verdünnt.

Anwendungsbeispiel 1 - Wirksamkeit gegen die Dürrfleckenkrankheit verursacht durch *Alternaria solani*

30 Blätter von Tomatenpflanzen der Sorte "Goldene Prinzessin" wurden mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am nächsten Tag wurden die behandelten Pflanzen mit einer Sporenaufschwemmung von *Alternaria solani*, in einer 2 %igen wässrigen Biomazlösung mit einer Dichte von $0,17 \times 10^6$ Sporen/ml infiziert. Anschließend wurden die
35 Versuchspflanzen in einer mit Wasserdampf gesättigten Kammer bei Temperaturen von 20 bis 22°C aufgestellt. Nach 5 Tagen hatte sich die Krankheit auf den unbehandelten, jedoch infizierten Pflanzen so stark entwickelt, dass der Befall visuell ermittelt werden konnte.

40 In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe aus Beispiel 1 keinen Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 90 % befallen waren.

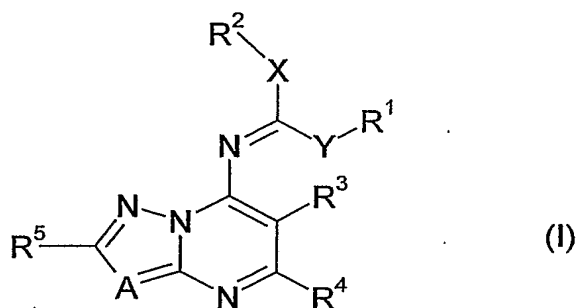
Anwendungsbeispiel 2 - Wirksamkeit gegen Netzfleckenkrankheit der Gerste verursacht durch *Pyrenophora teres* bei 1 Tag protektiver Anwendung

5 Blätter von in Töpfen gewachsenen Gerstenkeimlingen der Sorte "Igri" wurden mit wässriger Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. 24 Stunden nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension von *Pyrenophora [syn. Drechslera]* *teres*, dem Erreger der Netzfleckenkrankheit, inokuliert. Anschließend wurden die Pflanzen im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 24°C und 95 bis 100 %
10 relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt. Nach 6 Tagen wurde das Ausmaß der Mehltauentwicklung visuell anhand des Befalls der Blattfläche in % ermittelt.

15 In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe aus Beispiel 1 einen Befall $\leq 10\%$ während die unbehandelten Pflanzen zu 100 % befallen waren.

Patentansprüche

1. Azolopyrimidin-Verbindungen der allgemeinen Formel I



worin

A für N oder C-R⁶ steht;X, Y unabhängig voneinander für eine chemische Bindung oder für Sauerstoff, Schwefel oder eine Gruppe N-R⁷ stehen;

R¹, R² unabhängig voneinander für C₁-C₁₀-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₄-C₁₀-Alkadienyl, C₂-C₁₀-Alkynyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₅-C₈-Cycloalkenyl, C₅-C₁₀-Bicycloalkyl, Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl, Naphthyl, Naphthyl-C₁-C₄-alkyl, 5- oder 6-gliedriges gesättigtes, teilweise ungesättigtes oder aromatisches Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl, die jeweils 1, 2 oder 3 Heteroatome, ausgewählt unter N, O und S, als Ringglieder aufweisen können, stehen, wobei die als R¹, R² genannten Reste teilweise oder vollständig halogeniert sein können oder 1, 2, 3 oder 4 Reste R⁸ aufweisen können, wobei

Y-R¹ mit X-R² auch gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-, 6 oder 7-gliedrigen, gesättigten oder ungesättigten Carbo- oder Heterocyclus bilden können, wobei letzterer 1, 2, 3 oder 4 Heteroatome, ausgewählt unter O, S und N als Ringglied aufweisen kann, wobei der Carbo- und der Heterocyclus teilweise oder vollständig halogeniert sein können oder 1, 2, 3 oder 4 der Reste R⁷ und/oder R⁸ aufweisen können; wobei

Y-R¹ und Y-R² unabhängig voneinander auch für Wasserstoff, CN, NO₂ oder Halogen stehen können und wobei einer der Reste Y-R¹ und Y-R², auch OH, SH oder NH₂ bedeuten kann;

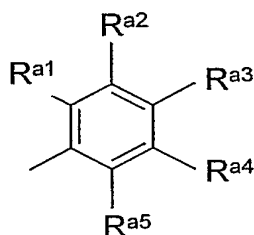
2

- 5 R^3 für C_1 - C_{10} -Alkyl, C_2 - C_{10} -Alkenyl, C_4 - C_{10} -Alkadienyl, C_2 - C_{10} -Alkinyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_5 - C_8 -Cycloalkenyl, C_5 - C_{10} -Bicycloalkyl, Phenyl, Naphthyl, einen 5- oder 6-gliedrigen, gesättigten, teilweise ungesättigten oder aromatischen Heterocyclus, der 1, 2 oder 3 Heteroatome, ausgewählt unter N, O und S, als Ringglieder aufweisen kann, steht, wobei die als R^3 genannten Reste teilweise oder vollständig halogeniert sein können oder 1, 2, 3 oder 4 Reste R^9 aufweisen können;
- 10 R^4 Halogen, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkinyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_5 - C_8 -Cycloalkenyl, OR^{10} , SR^{10} , $NR^{11}R^{12}$, $CH_2NR^{11}R^{12}$ oder $C(W)R^{13}$ bedeutet;
- 15 R^5, R^6 unabhängig voneinander für Wasserstoff, CN, NO_2 , NH_2 , CH_2NH_2 , Halogen, $C(W)R^{13}$, $C(=N-OR^{15})R^{14}$, $NHC(W)R^{16}$, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_2 - C_4 -Alkenyl stehen;
- 20 R^7 für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_1 - C_6 -Haloalkoxy, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkenyloxy, CN oder $C(W)R^{17}$ steht;
- 25 R^8 ausgewählt ist unter Halogen, Cyano, Nitro, OH, SH, $NR^{18}R^{19}$, C_1 - C_6 -Alkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, Hydroxy- C_1 - C_6 -alkyl, Hydrox- C_1 - C_6 -yalkoxy, C_1 - C_6 -Alkoxy- C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy- C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_1 - C_6 -Haloalkoxy, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkenyloxy, C_2 - C_6 -Alkinyl, C_2 - C_6 -Alkinyloxy, C_1 - C_6 -Alkylamino, $C(W)R^{13}$, $C(=N-OR^{15})R^{14}$, $NHC(W)R^{16}$, Tris- C_1 - C_6 -alkylsilyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl und Phenyl, das seinerseits 1, 2 oder 3 Reste aufweisen kann, die ausgewählt sind unter Cyano, Nitro, Halogen, OH, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_1 - C_6 -Haloalkoxy und C_1 - C_6 -Alkylthio;
- 30 R^9 für Halogen, Cyano, NH_2 , NO_2 , C_1 - C_6 -Alkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_1 - C_6 -Haloalkoxy, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkenyloxy, $C(W)R^{13}$, $C(=N-OR^{15})R^{14}$ oder $NHC(W)R^{16}$, steht;
- 35 R^{10} Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl oder $C(W)R^{13}$ bedeutet;
- 40 R^{11}, R^{12} unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_4 - C_6 -Alkadienyl, C_2 - C_6 -Alkinyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_5 - C_8 -Cycloalkenyl, stehen, wobei die als R^{11} , R^{12} genannten Reste teilweise oder vollständig halogeniert sein können oder 1, 2, 3 oder 4 Reste R^8 aufweisen können, wobei R^{11} auch für eine Gruppe $C(W)R^{13}$ stehen kann und wobei

3

- 5 R^{11}, R^{12} auch gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-, 6 oder 7-gliedrigen, gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus bilden können, der zusätzlich 1, 2 oder 3 weitere Heteroatome, ausgewählt unter O, S und N, als Ringglied aufweisen kann, wobei der Heterocyclus teilweise oder vollständig halogeniert sein und/oder 1, 2, 3 oder 4 der Reste R^8 aufweisen kann;
- 10 R^{13} für Wasserstoff, OH, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Haloalkyl, C_1 - C_6 -Haloalkoxy, C_2 - C_6 -Alkenyl oder $NR^{18}R^{19}$ steht;
- R^{14}, R^{15} unabhängig voneinander Wasserstoff oder C_1 - C_6 -Alkyl bedeuten;
- 15 R^{16}, R^{17} unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, NH_2 , C_1 - C_6 -Alkylamino oder Di- C_1 - C_6 -alkylamino stehen;
- R^{18}, R^{19} unabhängig voneinander die für R^{11} und R^{12} genannten Bedeutungen aufweisen; und
- 20 W für Sauerstoff oder Schwefel steht;
- die Tautomere der Verbindungen I sowie die landwirtschaftlich verträglichen Salze von Verbindungen I und von deren Tautomeren.
- 25 2. Verbindungen der allgemeinen Formel I nach Anspruch 1, worin wenigstens eine der Variablen X oder Y für eine chemische Bindung steht.
3. Verbindungen der allgemeinen Formel I nach Anspruch 2, worin eine der Gruppen $Y-R^1$ oder $X-R^2$ für Wasserstoff oder C_1 - C_4 -Alkyl steht.
- 30 4. Verbindungen der allgemeinen Formel I nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin beide Variablen X und Y für eine chemische Bindung stehen.
- 35 5. Verbindungen der allgemeinen Formel I nach Anspruch 4, worin R^1 und R^2 unabhängig voneinander ausgewählt sind unter Wasserstoff, C_1 - C_{10} -Alkyl, C_1 - C_{10} -Haloalkyl, C_3 - C_{10} -Alkenyl, C_3 - C_{10} -Haloalkenyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkenyl, C_3 - C_8 -Cyclo- C_1 - C_{10} -alkyl, C_3 - C_8 -Cyclo- C_1 - C_{10} -alkenyl, Phenyl oder Benzyl wobei die 6 letztgenannten Reste auch 1, 2, 3 oder 4 Substituenten, ausgewählt unter Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl und C_1 - C_4 -Alkoxy tragen können,
- 40 6. Verbindungen der allgemeinen Formel I nach Anspruch 4, worin eine der Gruppen R^1 oder R^2 für Halogen steht.

7. Verbindungen der allgemeinen Formel I nach Anspruch 6, worin die verbleibende Gruppe R^1 oder R^2 für Wasserstoff, C_1 - C_{10} -Alkyl, C_1 - C_{10} -Haloalkyl, C_3 - C_{10} -Alkenyl, C_3 - C_{10} -Haloalkenyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkenyl, C_3 - C_8 -Cyclo- C_1 - C_{10} -alkyl, C_3 - C_8 -Cyclo- C_1 - C_{10} -alkenyl, Phenyl oder Benzyl wobei die 6 letztgenannten Reste auch 1, 2, 3 oder 4 Substituenten, ausgewählt unter Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl und C_1 - C_4 -Alkoxy tragen können,
8. Verbindungen der allgemeinen Formel I nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin R^3 für einen Phenyl-Ring steht, der 1, 2, 3 oder 4 Reste R^9 aufweist.
9. Verbindungen der allgemeinen Formel I nach Anspruch 8, worin R^3 für eine Gruppe der Formel



15

steht, worin

- R^{a1} für Fluor, Chlor, Trifluormethyl oder Methyl;
 R^{a2} für Wasserstoff, Chlor oder Fluor;
 R^{a3} für Wasserstoff, CN, NO_2 , Fluor, Chlor, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy oder eine Gruppe $C(W)R^{13a}$, worin R^{13a} für C_1 - C_4 -Alkoxy, NH_2 , C_1 - C_4 -Alkylamino oder Di- C_1 - C_4 -alkylamino steht;
 R^{a4} für Wasserstoff, Chlor oder Fluor;
 R^{a5} für Wasserstoff, Fluor, Chlor oder C_1 - C_4 -Alkyl stehen.

20

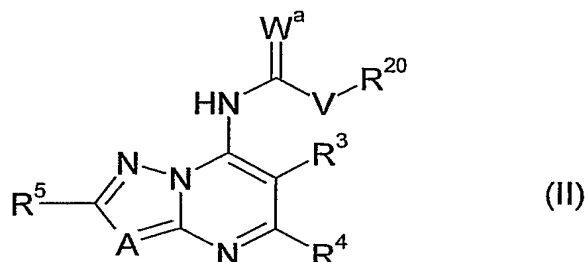
25

30

35

10. Verbindungen der allgemeinen Formel I nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin R^4 für Halogen, CN oder C_1 - C_4 -Alkyl steht.
11. Verbindungen der allgemeinen Formel I nach Anspruch 10, worin R^4 für Halogen steht.
12. Verbindungen der allgemeinen Formel I nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin R^5 für Wasserstoff steht.
13. Verbindungen der allgemeinen Formel I nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin A für $C-R^6$ steht.
14. Verbindungen der allgemeinen Formel I nach Anspruch 13, worin R^6 für Wasserstoff steht.

15. Verbindungen der allgemeinen Formel I nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin A für N steht.
16. Verbindungen nach einem der vorhergehenden Ansprüche in Form der Tautomere der allgemeinen Formel II



worin A, R³, R⁴ und R⁵ die zuvor für Formel I angegebenen Bedeutungen aufweisen,

V für eine chemische Bindung oder für Sauerstoff, Schwefel oder eine Gruppe N-R⁷ steht;

W^a für O, S oder eine Gruppe N-R²¹ steht;

R²⁰ eine der in Formel I für R¹ bzw. R² angegebenen Bedeutungen aufweist;

R²¹ eine der in Formel I für R¹ bzw. R² angegebenen Bedeutungen aufweist oder für Wasserstoff steht; und

wenn W^a für N-R²¹ steht, V-R²⁰ und N-R²¹ gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 5-, 6 oder 7-gliedrigen ungesättigten Heterocyc-
lus bilden können, wobei letzterer 1, 2, 3 oder 4 Heteroatome, ausgewählt unter O, S und N als Ringglied aufweisen kann, der teilweise oder vollständig halogeniert sein kann oder 1, 2, 3 oder 4 der zuvor genannten Reste R⁸ aufweisen kann.

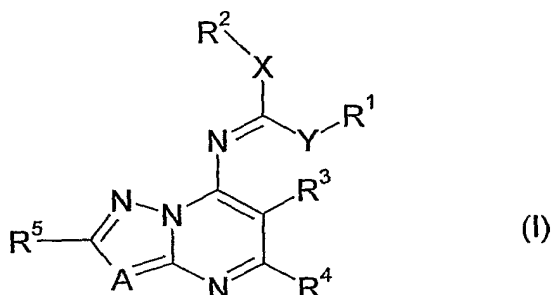
17. Verwendung von Verbindung der allgemeinen Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 16 und von deren landwirtschaftlich verträglichen Salzen zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Pilzen.
18. Mittel zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Pilzen, enthaltend wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 16 und/oder ein landwirtschaftlich verträgliches Salz von I und wenigstens einen flüssigen oder festen Trägerstoff.

- 5 19. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Pilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze, oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der allgemeinen Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 16 und/oder mit einem landwirtschaftlich verträglichen Salz von I behandelt.

Azolopyrimidin-Verbindungen und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen

Zusammenfassung

- 5 Die Erfindung betrifft Azolopyrimidin-Verbindungen der allgemeinen Formel I



gelöst, worin

A für N oder C-R⁶ steht;

X, Y unabhängig voneinander für eine chemische Bindung oder für Sauerstoff, Schwefel oder eine Gruppe N-R⁷ stehen;

worin die Variablen R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ die in den Ansprüchen und der Beschreibung angegebenen Bedeutungen aufweisen, Tautomere von Verbindungen der Formel I und die landwirtschaftlich verträglichen Salze von Verbindungen I und von deren Tautomeren. Die Erfindung betrifft weiterhin die Verwendung der Azolopyrimidin-Verbindungen der allgemeinen Formel I, ihrer Tautomere und deren landwirtschaftlich verträglichen Salze zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Pilzen (=Schadpilzen) sowie ein Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen und ein Mittel zur Bekämpfung von Schadpilzen, enthaltend wenigstens eine Verbindung der allgemeinen Formel I, ein Tautomer von I und/oder ein landwirtschaftlich verträgliches Salz davon oder von dessen Tautomer und wenigstens einen flüssigen oder festen Trägerstoff.